

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出版

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2002年11月28日 (28.11.2002)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 02/094825 A1

(51) 国際特許分類: C07D 471/10, 471/20, 491/107, 491/20, 519/00, A61K 31/438, 31/444, 31/4709, 31/4747, 31/497, 31/506, A61P 1/00, 3/04, 3/06, 3/10, 5/00, 9/00, 9/10, 9/12, 9/14, 11/00, 13/12, 15/00, 25/00, 25/04, 25/08, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30, 25/32, 27/06, 29/00, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/04954

(22) 国際出願日: 2002年5月22日 (22.05.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2001-152019 2001年5月22日 (22.05.2001) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒103-8416 東京都中央区日本橋本町2丁目2番3号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 深見 竹広 (FUKAMI, Takehiro) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 守谷 実 (MORIYA, Minoru) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 菅 卓哉

(SUGA, Takuya) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県つくば市大久保3番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP).

(74) 共通の代表者: 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.); 〒103-8416 東京都中央区日本橋本町2丁目2番3号 Tokyo (JP).

(81) 指定国/国内: AE, AG, AI, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

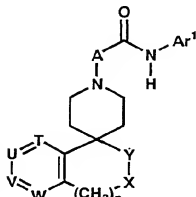
(84) 指定国(広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: NOVEL SPIROPERIDINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 新規スピロペリジン誘導体



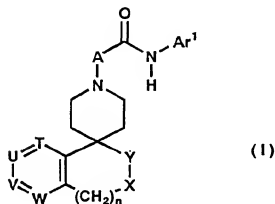
(1)

(57) Abstract: A compound represented by the general formula (I):  
(I) [wherein A means optionally substituted C<sub>1-3</sub> linear alkylene; Ar<sup>1</sup> means optionally substituted aryl or heteroaryl; n is 0 or 1; T, U, V, and W each means an optionally substituted methine group or a nitrogen atom, provided that at least two of these mean the methine group; X means a group represented by -N(SO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>), -N(COR<sup>2</sup>), or -CO-; and Y means a group represented by -C(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>), -O-, or -N(R<sup>5</sup>)]. The compound has NPY antagonism and is hence useful as a remedy for various diseases in which NPY participates, i.e., circulatory diseases such as hypertension, central diseases such as hyperphagia, metabolic diseases such as obesity and diabetes, sexual and reproductive dysfunction, digestive diseases such as movement disorders of the digestive tract, respiratory diseases, inflammation, glaucoma, etc.



(57) 要約:

本発明は、一般式 (I)



〔式中、Aは置換基を有していてもよい炭素数1乃至3の直鎖状アルキレン基を；Ar<sup>1</sup>は置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を；nは0又は1を；T、U、V及びWは置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を；Xは—N(SO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>)—、—N(COR<sup>2</sup>)—、又は—CO—で表される基を；Yは—C(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>)—、—O—、又は—N(R<sup>5</sup>)—で表される基を意味する〕で表される化合物等に関する。

本発明の化合物は、NPY拮抗作用を有するため、NPYが関与する各種の疾患、即ち、高血圧等の循環器系疾患、過食症等の中枢性疾患、肥満症、糖尿病等の代謝性疾患、性及び生殖機能障害、消化管運動障害等の消化器系疾患、呼吸器系疾患、炎症又は緑内障等の処置剤として有用である。

# 明 細 書

新規スピロペリジン誘導体

## 5 技 術 分 野

本発明は医薬の分野において有用である。更に詳しくは、本発明の新規スピロペリジン誘導体は、神経ペプチドY受容体拮抗物質として、各種の循環器系疾患、中枢神経系疾患、代謝系疾患等の処置剤として有用である。

## 10 背 景 技 術

神経ペプチドY（以下NPYと称す）は36アミノ酸からなるペプチドであり、1982年、立元らにより豚脳より初めて単離された〔ネイチャー（Nature）、296巻、659頁（1982年）〕。NPYは中枢神経系及び末梢神経系に広く分布し、神経系における最も多量に存在するペプチドの一つとして、  
15 生体において多様な機能を司っている。すなわち、NPYは中枢において食欲促進物質として働くとともに、各種ホルモンの分泌又は神経系の作用を介して脂肪蓄積を顕著に促進する。NPYの脳室内連続投与はこれらの作用に基づき、肥満及びインスリン抵抗性を誘発することが知られている〔インターナショナル・ジャーナル・オブ・オベシティー（International Journal  
20 of Obesity）、19巻、517頁（1995年）；エンドクリノロジー（Endocrinology）、133巻、1753頁（1993年）〕。また、その他、うつ病、不安、精神分裂、痛み、痴呆及び概日リズムの調節などの中樞作用を持つことが知られている〔ドラッグス（Drugs）、52巻、371頁（1996）；ザ・ジャーナル・オブ・ニューロサイエンス（The  
25 Journal of Neuroscience）、18巻、3014頁（1998年）〕。更に、末梢では、NPYは交感神経終末にノルエピネフリンと共存し、交感神経系の緊張性と関係している。NPYの末梢投与は血管収縮を引き起こし、またノルエピネフリンを初めとする他の血管収縮物質の作用を増強するこ

とが知られている [ブリティッシュ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー (British Journal of Pharmacology)、95巻、419頁 (1988年)]。更に交感神経系の亢進にともなう心肥大を助長することも報告されている [プロシーディング・ナショナル・アカデミック・サイエンス・ユーエスエー (Proceeding National Academic Science USA)、97巻、1595頁 (2000年)]。

その他、性ホルモン及び成長ホルモンの分泌能、性及び生殖機能、消化管運動、気管支収縮、炎症及びアルコールに対する嗜好性への関与も報告されている [ライフ・サイエンス (Life Science)、55巻、551頁 (1994年)]；ザ・ジャーナル・オブ・アレルギー・アンド・クリニカル・イムノロジー (The Journal of Allergy and Immunology)、101巻、S345頁 (1998年)；ネイチャー (Nature)、396巻、366頁 (1998年)]。

NPYは、その類縁体であるペプチドYY及びパンクレアティック・ポリペプチドと一部共通の受容体を介して、多種多様な薬理作用を有する。これらNPYによる薬理作用は少なくとも5種類の受容体の単独あるいは相互作用を介して惹起されることが知られている [トレンツ・イン・ニューロサイエンス (Trends in Neuroscience)、20巻、294頁 (1997年)]。

NPY Y1受容体を介する中枢作用としては、顕著な食欲促進作用が報告されている [エンドクリノロジー (Endocrinology)、137巻、3177頁 (1996年)；エンドクリノロジー (Endocrinology)、141巻、1011頁 (2000年)]。更に不安感や痛みへの関与も報告されている [ネイチャー (Nature)、259巻、528頁 (1993年)；ブレイン・リサーチ (Brain Research)、859巻、361頁 (2000年)]。また、末梢においては強力な血管収縮作用を介した血圧上昇作用が報告されている [フェブス・レター (FEBS Letters)、362巻、192頁、(1995年)；ネイチャー・メディシン (Nature Medicine)、4巻、722頁 (1998年)]。

NPY Y2受容体を介する作用としては、神経終末において各種神経伝達物質の放出を阻害することが知られている [ブリティッシュ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー (British Journal of Pharmacology)、102巻、41頁 (1991年) ; シナプス (Synapse) 2巻、299頁 (1988年) ]。また、末梢においては、これら神経伝達物質の制御あるいは直接の作用として、血管又は輸精管の収縮に関与する [ザ・ジャーナル・オブ・ファルマコロジー・アンド・エクスperimental・セラピューティクス (The Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics)、261巻、863頁 (1992年) ; ブリティッシュ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー (British Journal of Pharmacology)、100巻、190頁 (1990年) ]。また、脂肪組織においては、脂肪分解作用の抑制が知られている [エンドクリノロジー (Endocrinology)、131巻、1970頁 (1992年) ]。更に消化管においては、イオン分泌を阻害することが報告されている [ブリティッシュ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー (British Journal of Pharmacology)、101巻、247頁 (1990年) ]。一方、記憶及び不安感等の中枢作用も知られている [ブレイン・リサーチ (Brain Research)、503巻、73頁 (1989年) ; ペプチド (Peptides)、19巻、359頁 (1998年) ]。

NPY Y3受容体は、主に脳幹及び心臓に発現しており、血圧、心拍数の制御に関与していることが報告されている [ザ・ジャーナル・オブ・ファルマコロジー・アンド・エクスperimental・セラピューティクス (The Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics)、258巻、633頁 (1991年) ; ペプチド (Peptides)、11巻、545頁 (1990年) ]。更に、副腎においてはカテコールアミンの分泌に関与することが知られている [ザ・ジャーナル・オブ・ファルマコロジー・アンド・エクスperimental・セラピューティクス (The Journal of Pharmacology and Expe

rimental Therapeutics)、244巻、468頁(1988年);ライフ・サイエンス(Life Science)、50巻、PL7頁(1992年)]。

- NPY Y4受容体は特にパンクレアティック・ポリペプチドとの親和性が
- 5 高く、薬理作用としては、腺外分泌及び消化管運動の抑制が報告されている[ガストロエンテロロジー(Gastroenterology)、85巻、1411頁(1983年)]。更に中枢においては、性ホルモンの分泌を促進することが知られている[エンドクリノロジー(Endocrinology)、140巻、5171頁(1999年)]。
- 10 NPY Y5受容体を介する作用としては、食欲促進効果を含む脂肪蓄積作用が顕著である[ネイチャー(Nature)、382巻、168頁(1996年)];アメリカン・ジャーナル・オブ・フィジオロジー(American Journal of Physiology)、277巻、R1428頁(1999年)]。また、痙攣及びてんかんへの関与又は痛み及びモルヒネ投与の中止に
- 15 伴う禁断症状への関与更に概日リズムの調節等の中枢作用が報告されている[ネイチャー・メディスン(Nature Medicine)、3巻、761頁(1997年)];プロシーディング・ナショナル・アカデミック・サイエンス・ユーエスエー(Proceeding National Academic Science USA)、96巻、13518頁(1999年)];ザ・ジャーナル・オブ・ファルマコロジー・アンド・エクスペリメンタル・セラピューティクス(The Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics)、284巻、633頁(1998年)];ザ・ジャーナル・オブ・ニューロサイエンス(The Journal of Neuroscience)、21巻、5367頁(2001年)
- 20 ]。更に末梢においては、利尿作用及び血糖降下作用が報告されている[ブリティッシュ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー(British Journal of Pharmacology)、120巻、1335頁(1998年)];エンドクリノロジー(Endocrinology)、139巻、3018頁(1998年)]。更に交感神経系の亢進にともなう心肥大を助長することも報
- 25

告されている [プロシーディング・ナショナル・アカデミック・サイエンス・ユーエスエー (Proceeding National Academic Science USA)、97巻、1595頁 (2000)]。

NPYの機能は中枢又は末梢神経系に存在するNPY受容体を結合することにより発現される。したがって、NPYのNPY受容体との結合を阻害すれば、NPYの作用発現を阻止することができる。その結果、NPYのNPY受容体結合に拮抗する物質はNPYが関与する各種疾患、例えば高血圧、腎臓病、心疾患、血管れん縮等の循環器系疾患、例えば過食症、うつ病、不安、痙攣、てんかん、痴呆、痛み、アルコール依存症、薬物の断薬に伴う禁断症状、概日リズムの変調、精神分裂病 (統合失調症) 等の中枢性疾患、例えば肥満症、糖尿病、ホルモン異常等の代謝性疾患、性及び生殖機能障害、消化管運動障害、呼吸器系疾患、炎症又は緑内障等の予防又は治療における有用性が期待できる [トレンツ・イン・ファーマコロジカル・サイエンス (Trends in Pharmacological Science)、15巻、153頁 (1994年) ; ライフ・サイエンス (Life Science)、55巻、551頁 (1994年) ; ドラッグス (Drugs)、52巻、371頁 (1996年) ; ザ・ジャーナル・オブ・アレルギー・アンド・クリニカル・イムノロジー (The Journal of Allergy and Immunology)、101巻、S345頁 (1998年) ; ネイチャー (Nature)、396巻、366頁 (1998年) ; ザ・ジャーナル・オブ・ファルマコロジー・アンド・エクスペリメンタル・セラピューティクス (The Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics)、284巻、633頁 (1998年) ; トレンツ・イン・ファーマコロジカル・サイエンス (Trends in Pharmacological Science)、20巻、104頁 (1999年) ; プロシーディング・ナショナル・アカデミック・サイエンス・ユーエスエー (Proceeding National Academic Science USA)、97巻、1595頁 (2000) ; ザ・ジャーナル・オブ・ニューロサイエンス (The Journal of Neuroscience)、21巻、5367頁 (2001年)]。

；ファルマコロジー・アンド・セラピューティクス（Pharmacology & Therapeutics）、65巻、397頁（1995年）]。

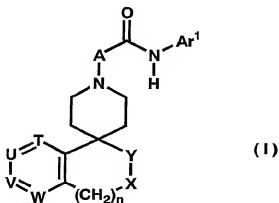
また、最近、本発明者らの研究により、ある種のNPY受容体拮抗物質が、高コレステロール血症、高脂血症、動脈硬化症の予防又は治療において有用であることが見出された（国際公開WO99/27965号；WO00/27845号；WO01/14376号）。

本発明の化合物と構造的に関連する化合物としては、国際公開WO98/35957号にアミド誘導体およびNPY拮抗作用について開示されている。しかしながら、この刊行物に本発明の化合物は何ら具体的に開示も示唆もされていない。

## 発 明 の 開 示

本発明の目的は、NPY拮抗作用を有する新規な薬剤を提供することにある。

本発明者らは、一般式（I）



- 〔式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar<sup>1</sup>はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-Ar<sup>2</sup>で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar<sup>2</sup>はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ



- 基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； $n$ は0又は1を意味し； $Q$ は単結合又はカルボニル基を意味し； $R^1$ は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し； $R^2$ 及び $R^5$ は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し； $R^3$ 及び $R^4$ は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し； $T$ 、 $U$ 、 $V$ 及び $W$ は、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよい
- 10 メチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味し； $X$ は $-N(SO_2R^1)-$ 、 $-N(COR^2)-$ 又は $-CO-$ で表される基を意味し； $Y$ は $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-O-$ 又は $-N(R^5)-$ で表される基を意味する」で表される化合物がNPY拮抗作用を有し、NPYが関与する各種の疾患の処置剤として有用であることを見出し、本発明を完成した。
- 15 本発明化合物(I)は、NPYが関与する各種の疾患、すなわち、例えば高血圧、腎臓病、心疾患、血管れん縮、動脈硬化症等の循環器系疾患、例えば過食症、うつ病、不安、痙攣、てんかん、痴呆、痛み、アルコール依存症、薬物の断薬に伴う禁断症状、概日リズムの変調、精神分裂病(統合失調症)等の中枢性疾患、例えば肥満症、糖尿病、ホルモン異常、高コレステロール血症、高脂血症等の代謝性疾患、性及び生殖機能障害、例えば消化管運動障害等の消化器系疾患、呼吸器系疾患、炎症又は緑内障等の処置剤として有用である。
- 20

特に、本発明化合物(I)は、例えば過食症、肥満症、糖尿病等の処置剤として有用である。

- 25 本発明は、一般式(I)で表される化合物、その塩又はエステル並びにそれらの製造法及び用途に関する。

以下に、本明細書において用いられる用語の意味を記載し、本発明について更に詳細に説明する。

「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子を意味する。

「低級アルキル基」とは、炭素数1ないし6の直鎖状又は分岐状のアルキル基を意味し、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ヘキシル基、イソヘキシル基等が挙げられる。

- 5 「アリール基」とは、炭素数6ないし16の芳香族性を有する環式炭化水素及びその誘導体から形成される基を意味し、例えばフェニル基、トリル基、キシリル基、メシチル基、クメニル基、ナフチル基、アントリル基、フェナントリル基、ビレニル基、インダニル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル基、アセナフテニル基、フルオレニル基等が挙げられる。

- 10 「アラルキル基」とは、置換可能な任意の位置が1又は2以上、好ましくは1の前記アリール基で置換された前記低級アルキル基を意味し、例えばベンジル基、1-フェニルエチル基、フェネチル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基等が挙げられる。

- 15 「炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基」とは、メチレン基、エチレン基、トリメチレン基を意味する。

- 「ハロ低級アルキル基」とは、置換可能な任意の位置が1又は2以上、好ましくは1ないし3の同一又は異なる前記ハロゲン原子で置換された前記低級アルキル基を意味し、例えばフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、2-フルオロエチル基、1, 2-ジフルオロエチル基、クロロメチル基、20 2-クロロエチル基、1, 2-ジクロロエチル基、プロモメチル基、ヨードメチル基等が挙げられる。

- 「ヒドロキシ低級アルキル基」とは、置換可能な任意の位置が1又は2以上、好ましくは1又は2の水酸基で置換された前記低級アルキル基を意味し、例えばヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル基、1, 2-ジヒドロキシエチル基、3-ヒドロキシプロピル基等が挙げら25 れる。

「シクロ低級アルキル基」とは、炭素数3ないし6のシクロアルキル基を意味し、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基が挙げられる。

「低級アルケニル基」とは、炭素数2ないし6の直鎖又は分岐状のアルケニル基を意味し、例えばビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、イソプロペニル基、3-ブテニル基、2-ブテニル基、1-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、1-メチル-1-プロペニル基、1-エチル-1-エテニル基、  
5 2-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-1-プロペニル基、3-メチル-2-ブテニル基、4-ペンテニル基等が挙げられる。

「低級アルコキシ基」とは、炭素数1ないし6の直鎖状又は分岐状のアルコキシ基を意味し、例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、sec-ブトキシ基、イソブトキシ基、tert-ブトキシ基、  
10 ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基等が挙げられる。

「ハロ低級アルコキシ基」とは、置換可能な任意の位置が1又は2以上、好ましくは1ないし3の同一又は異なる前記ハロゲン原子で置換された前記低級アルコキシ基を意味し、例えばフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフ  
15 ルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、1, 2-ジフルオロエトキシ基、クロロメトキシ基、2-クロロエトキシ基、1, 2-ジクロロエトキシ基、プロモメトキシ基、ヨードメトキシ基等が挙げられる。

「低級アルキルチオ基」とは、炭素数1ないし6の直鎖状又は分岐状のアルキルチオ基を意味し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソ  
20 プロピルチオ基、ブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、イソブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、ペンチルチオ基、イソペンチルチオ基、ヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基等が挙げられる。

「低級アルカノイル基」とは、前記低級アルキル基を有するアルカノイル基、すなわち、炭素数2ないし7のアルカノイル基を意味し、例えばアセチル基、  
25 ロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、パレリル基、イソパレリル基、ピバロイル基等が挙げられる。

「低級アルコキシカルボニル基」とは、前記低級アルコキシ基を有するアルコキシカルボニル基、すなわち、炭素数2ないし7のアルコキシカルボニル基を意味し、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボ

ニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基等が挙げられる。

「ヘテロアリール基」とは、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子からなる群より、

- 5 同一若しくは異なって選ばれる1若しくは2以上、好ましくは1ないし3の複素原子を含有する5員若しくは6員の単環式芳香族複素環基又は該単環式芳香族複素環基と前記アリール基が縮合した、若しくは同一若しくは異なる該単環式芳香族複素環基が互いに縮合した縮合環式芳香族複素環基を意味し、例えばピロリル基、フリル基、チエニル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、オキサジアゾリル基、1, 2, 3-チアジアゾリル基、1, 2, 4-チアジアゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、1, 2, 4-トリアジニル基、1, 3, 5-トリアジニル基、インドリル基、ベンゾフラニル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾイソオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾイソチアゾリル基、インダゾリル基、プリニル基、キノリル基、イソキノリル基、フタラジニル基、ナフチリジニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、シンノリニル基、プテリジニル基、1, 5-ナフチリジニル基等が挙げられる。

- 20 「低級アルキルアミノ基」とは、前記低級アルキル基でモノ置換されたアミノ基を意味し、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、sec-ブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基等が挙げられる。

- 25 「ジ低級アルキルアミノ基」とは、同一又は異なる前記低級アルキル基でジ置換されたアミノ基を意味し、例えばジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジプロピルアミノ基、メチルプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基等が挙げられる。

一般式(I)で表される化合物の「塩」とは、医薬として許容されうる慣用的なものを意味し、例えばカルボキシル基を有する場合の当該カルボキシル基にお

ける塩基付加塩又はアミノ基若しくは塩基性の複素環基を有する場合の当該塩基性複素環基における酸付加塩の塩類を挙げることができる。

該塩基付加塩としては、例えばナトリウム塩、カリウム塩等のアルカリ金属塩；例えばカルシウム塩、マグネシウム塩等のアルカリ土類金属塩；例えばアンモ  
5 ニウム塩；例えばトリメチルアミン塩、トリエチルアミン塩、ジシクロヘキシルアミン塩、エタノールアミン塩、ジエタノールアミン塩、トリエタノールアミン塩、プロカイン塩、N, N'-ジベンジルエチレンジアミン塩等の有機アミン塩等が挙げられる。

該酸付加塩としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩、過塩素酸塩  
10 等の無機酸塩；例えばマレイン酸塩、フマル酸塩、酒石酸塩、クエン酸塩、アスコルビン酸塩、トリフルオロ酢酸塩等の有機酸塩；例えばメタンスルホン酸塩、イセチオン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩等のスルホン酸塩等が挙げられる。

一般式(I)で表される化合物の「エステル」としては、例えばカルボキシル  
15 基を有する場合の当該カルボキシル基における医薬として許容されうる慣用的なものを意味し、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基等の低級アルキル基とのエステル、ベンジル基、フェネチル基等のアラルキル基とのエ  
20 ステル、アリル基、2-ブテニル基等の低級アルケニル基とのエステル、メトキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基等の低級アルコキシ低級アルキル基とのエステル、アセトキシメチル基、ピパロイルオキシメチル基、1-ピパロイルオキシエチル基等の低級アルカノイルオキシ低級アルキル基との  
25 エステル、メトキシカルボニルメチル基、イソプロポキシカルボニルメチル基等の低級アルコキシカルボニル低級アルキル基とのエステル、カルボキシメチル基等のカルボキシ低級アルキル基とのエステル、1-(エトキシカルボニルオキシ)エチル基、1-(シクロヘキシルオキシカルボニルオキシ)エチル基等の低級アルコキシカルボニルオキシ低級アルキル基とのエステル、カルバモイルオキシメチル基等のカルバモイルオキシ低級アルキル基とのエステル、フタリジル基と

のエステル、（５－メチルー２－オキソ－１，３－ジオキソールー４－イル）メチル基等の（５－置換－２－オキソ－１，３－ジオキソールー４－イル）メチル基とのエステル等が挙げられる。

- 「処置剤」とは、各種疾患に対して治療及び／又は予防の目的で供せられる薬  
5 剤を意味する。

前記一般式（Ⅰ）で表される本発明の化合物を更に具体的に開示するため、式（Ⅰ）において用いられる各種記号につき、その好適な具体例を挙げて更に詳細に説明する。

- Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される  
10 置換基を有していてもよい炭素数１ないし３の直鎖状アルキレン基を意味する。

「低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数１ないし３の直鎖状アルキレン基」とは、無置換の前記炭素数１ないし３の直鎖状アルキレン基、又は置換可能な任意の位置に置換基を有する前記炭素数１ないし３の直鎖状アルキレン基を意味し、該置換基は  
15 低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より、同一又は異なって１又は２以上、好ましくは１又は２選択することができる。

該置換基の低級アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基等が好適である。

- 該置換基のアラルキル基としては、例えばベンジル基、フェネチル基等が好適  
20 である。

該置換基のアリール基としては、例えばフェニル基等が好適である。

該置換基としては、例えば低級アルキル基等が好適である。

Aの炭素数１ないし３の直鎖状アルキレン基としては、例えばメチレン基、エチレン基等、より好ましくはメチレン基等が好適である。

- したがって、Aとしては、具体的には、例えばメチレン基、エチレン基、トリメチレン基、エチリデン基、プロピリデン基、イソプロピリデン基、ベンジリデン基、フェネチリデン基、１－メチルエチレン基、１，２－ジメチルエチレン基等が挙げられ、中でもメチレン基、エチレン基、エチリデン基等、より好ましくはメチレン基等が好適である。

A r<sup>1</sup>はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-A r<sup>2</sup>で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味する。

「ハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-A r<sup>2</sup>で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基」とは、無置換の前記アリール基若しくは前記ヘテロアリール基、又は置換可能な任意の位置に置換基を有する前記アリール基若しくは前記ヘテロアリール基を意味し、該置換基はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-A r<sup>2</sup>で表される基からなる群より、同一又は異なって1又は2以上、好ましくは1又は2選択することができる。

該置換基のハロゲン原子としては、例えばフッ素原子、塩素原子等が好適である。

該置換基の低級アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基等が好適である。

該置換基のハロ低級アルキル基としては、例えばジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基等が好適である。

該置換基のヒドロキシ低級アルキル基としては、例えばヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル基等が好適である。

該置換基のシクロ低級アルキル基としては、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基等が好適である。

該置換基の低級アルケニル基としては、例えばビニル基、1-プロペニル基、2-メチル-1-プロペニル基等が好適である。

該置換基の低級アルコキシ基としては、例えばメトキシ基、エトキシ基等が好適である。

- 5 該置換基のハロ低級アルコキシ基としては、例えばフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基等が好適である。

該置換基の低級アルキルチオ基としては、例えばメチルチオ基、エチルチオ基等が好適である。

- 10 該置換基の低級アルカノイル基としては、例えばアセチル基、プロピオニル基等が好適である。

該置換基の低級アルコキシカルボニル基としては、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基等が好適である。

- 15 該置換基の-Q-Ar<sup>2</sup>で表される基において、Ar<sup>2</sup>はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味する。

- 20 「ハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基」とは、無置換の前記アリール基若しくは前記ヘテロアリール基、又は置換可能な任意の位置に置換基を有する前記アリール基若しくは前記ヘテロアリール基を意味し、該置換基はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より、同一又は異なって1又は2以上、好ましくは1又は2選択することができる。
- 25



該置換基のハロゲン原子としては、例えばフッ素原子、塩素原子等が好適である。

該置換基の低級アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基等が好適である。

- 5 該置換基のハロ低級アルキル基としては、例えばジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基等が好適である。

該置換基のヒドロキシ低級アルキル基としては、例えばヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル基等が好適である。

- 10 該置換基の低級アルコキシ基としては、例えばメトキシ基、エトキシ基等が好適である。

該置換基のハロ低級アルコキシ基としては、例えばフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基等が好適である。

該置換基の低級アルキルアミノ基としては、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基等が好適である。

- 15 該置換基のジ低級アルキルアミノ基としては、例えばジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基等が好適である。

該置換基の低級アルカノイル基としては、例えばアセチル基、プロピオニル基等が好適である。

該置換基のアリール基としては、例えばフェニル基等が好適である。

- 20  $Ar^2$ の置換基としては、例えばハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、ハロ低級アルコキシ基等が好適である。

$Ar^2$ のアリール基としては、例えばフェニル基等が、ヘテロアリール基としては、例えばイミダゾリル基、ピリジル基、ベンゾフラニル基、キノリル基等が

- 25 好適である。

したがって、 $-Q-Ar^2$ で表される基としては、例えばフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基等が好適である。

- ル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、  
2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フル  
ルオロ-5-メチルフェニル基、3-フルオロメチルフェニル基、2-トリフル  
オロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロ  
5 メチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メ  
トキシフェニル基、3-フルオロ-5-メトキシフェニル基、3-フルオロメト  
キシフェニル基、3-ジフルオロメトキシフェニル基、3-(2-ヒドロキシエ  
チル)フェニル基、3-ヒドロキシメチルフェニル基、3-(1-ヒドロキシ  
1-メチルエチル)フェニル基、3-ヒドロキシフェニル基、4-ヒドロキシフ  
10 エニル基、2-イミダゾリル基、1-メチル-2-イミダゾリル基、1-エチル  
-2-イミダゾリル基、2-チアゾリル基、2-エチル-4-チアゾリル基、1,  
2, 4-チアジアゾール-5-イル基、1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
基、2-ビリジル基、3-ビリジル基、4-ビリジル基、2-エチル-4-ビリ  
ジル基、5-メトキシ-3-ビリジル基、4-ビリミジニル基、5-ビリミジニ  
15 ル基、4-ベンゾ[b]フラニル基、5-ベンゾ[b]フラニル基、7-ベンゾ  
[b]フラニル基、2-キノリル基、3-キノリル基、4-キノリル基、5-キノ  
リル基、6-キノリル基、8-キノリル基、ベンゾイル基、2-ビリジルカル  
ボニル基等が挙げられ、中でもフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フル  
オロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-  
20 クロロフェニル基、3-シアノフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、  
3-ジフルオロメトキシフェニル基、3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル基、  
3-ヒドロキシフェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、1-エチル-2-イミ  
ダゾリル基、2-ビリジル基、7-ベンゾ[b]フラニル基、2-キノリル基、  
3-キノリル基、ベンゾイル基、2-ビリジルカルボニル基等、より好ましくは  
25 フェニル基、ベンゾイル基等が好適である。

A<sub>r</sub><sup>1</sup>の置換基としては、例えばハロゲン原子、オキソ基、低級アルキル基、  
ハロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、低級アルカノイル  
基、-Q-A<sub>r</sub><sup>2</sup>で表される基等、より好ましくは、ハロゲン原子、オキソ基、  
低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルカノイル基、-Q-A<sub>r</sub><sup>2</sup>で表さ

れる基等が好適である。

Ar<sup>1</sup>のアリール基としては、例えばフェニル基、ナフチル基、フルオレニル基等、より好ましくはフェニル基等が、ヘテロアリール基としては、例えばイミダゾリル基、ピラゾリル基、チアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、1, 2, 4-チアジアゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、1, 2, 4-トリアジニル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ピリド[3, 2-d]チアゾリル基、キノリル基、キノキサリニル基、1, 5-ナフチリジニル基等が好適である。

したがって、Ar<sup>1</sup>としては、例えば3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、4-アセチルフェニル基、5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル基、4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-ピフェニル基、3-ピフェニル基、4-ピフェニル基、4-(1-メチル-2-イミダゾリル)フェニル基、4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル基、4-(2-チアゾリル)フェニル基、4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル基、3-(2-ピリジル)フェニル基、3-(4-ピリジル)フェニル基、4-(2-ピリジル)フェニル基、4-(3-ピリジル)フェニル基、4-(4-ピリジル)フェニル基、4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル基、4-(4-ピリミジニル)フェニル基、4-ベンゾイルフェニル基、4-(2-ピリジルカルボニル)フェニル基、1-ナフチル基、9-オキソ-3-フルオレニル基、1-メチル-2-イミダゾリル基、1-フェニル-4-イミダゾリル基、1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-トリフルオロメチルフェ

- ニル) - 4-イミダゾリル基、1- [3- (2-ヒドロキシエチル) フェニル]  
- 4-イミダゾリル基、1- [3- (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェ  
ニル] - 4-イミダゾリル基、1- (3-メトキシフェニル) - 4-イミダゾリ  
ル基、1- (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル基、1- (
- 5 3-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル基、1- (4-ジフルオ  
ロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル基、1- (2-ピリジル) - 4-イミ  
ダゾリル基、1- (4-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル基、1- (
- 10 5-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル基、1- (7-ベンゾ [b] フ  
ラニル) - 4-イミダゾリル基、1- (2-キノリル) - 4-イミダゾリル基、  
1- (3-キノリル) - 4-イミダゾリル基、1- (4-キノリル) - 4-イミ  
ダゾリル基、1- (5-キノリル) - 4-イミダゾリル基、1- (6-キノリル  
) - 4-イミダゾリル基、1- (8-キノリル) - 4-イミダゾリル基、1-フ  
ェニル-3-ピラゾリル基、5-フェニル-3-ピラゾリル基、5- (2-フル  
オロフェニル) - 3-ピラゾリル基、5- (3-フルオロフェニル) - 3-ピラ
- 15 ゾリル基、5- (4-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル基、5- (2-クロ  
ロフェニル) - 3-ピラゾリル基、5- (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリ  
ル基、5- (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル基、5- (3-メトキシフ  
ェニル) - 3-ピラゾリル基、5- (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-  
ピラゾリル基、5- (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル基、
- 20 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル基、5- (2-ピリジル) - 3-ピ  
ラゾリル基、5- (5-メトキシ-3-ピリジル) - 3-ピラゾリル基、5- (
- 2-キノリル) - 3-ピラゾリル基、5- (3-キノリル) - 3-ピラゾリル基、  
2-エチル-4-チアゾリル基、4-フェニル-2-チアゾリル基、5-フェニ  
ル-2-チアゾリル基、5- (3-クロロフェニル) - 2-チアゾリル基、5-
- 25 (4-クロロフェニル) - 2-チアゾリル基、5- (4-メトキシフェニル) -  
2-チアゾリル基、5- (2-ピリジル) - 2-チアゾリル基、4-フェニル-  
2-オキサゾリル基、5-フェニル-2-オキサゾリル基、4- (3-メトキシ  
フェニル) - 2-オキサゾリル基、4- (2-フルオロメトキシフェニル) - 2  
-オキサゾリル基、4- (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル

- 基、3-フェニル-5-イソオキサゾリル基、3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル基、3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル基、3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル基、3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル基、5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル基、5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル基、5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル基、5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル基、5-フェニル-2-ピリジル基、5-フェニル-3-ピリジル基、6-フェニル-3-ピリジル基、2-フェニル-4-ピリジル基、5-(2-ピリジル)-2-ピリジル基、5-ベンゾイル-2-ピリジル基、6-ベンゾイル-3-ピリジル基、5-クロロ-2-ピラジニル基、5-(1-メチルピニル)-2-ピラジニル基、5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル基、5-アセチル-2-ピラジニル基、5-プロピオニル-2-ピラジニル基、5-フェニル-2-ピラジニル基、5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル基、5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル基、5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル基、5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル基、5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル基、5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル基、5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル基、5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル基、5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル基、5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル基、5-(3-キノリル)-2-ピラジニル基、5-ベンゾイル-2-ピラジニル基、5-(2-ピリジルカルボニル)-2-ピラジニル基、5-アセチル-2-ピリミジニル基、5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル基、4-フェニル-2-ピリミジニル基、5-フェニル-2-ピリミジニル基、2-フェニル-4-ピリミジニル基、6-フェニル-4-ピリミジニル基、2-フェニル-5-ピリミジニル基、5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-クロロフ

- エニル) - 2-ピリミジニル基、5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-  
 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル基、6-  
 15-フェニル-3-ピリダジニル基、6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル基、5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル基、4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル基、2-ベンゾチアゾリル基、5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル基、4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル基、6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル基、4-メチル-2-ベンゾチアゾリル基、2-メチル-5-ベンゾチアゾリル基、4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル基、5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル基、6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル基、3-キノリル基、6-キノリル基、6-メチル-2-キノリル基、7-メチル-2-キノリル基、8-メチル-2-キノリル基、2-メチル-6-キノリル基、6-クロロ-2-キノキサリニル基、7-クロロ-2-キノキサリニル基、6-メチル-2-キノキサリニル基、1, 5-ナフチリジン-2-イル基、7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル基、7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル基、7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル基、7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル基、7-アセチル-1, 5-ナ

- フチリジン-2-イル基等が挙げられ、中でも3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、4-アセチルフェニル基、5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル基、4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-ピフェニル基、3-ピフェニル基、4-  
5 ピフェニル基、4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル基、4-ベンゾイルフェニル基、4-(2-ピリジルカルボニル)フェニル基、1-ナフチル基、9-オキソ-3-フルオレニル基、1-フェニル-4-イミダゾリル基、1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル基、1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル基、1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル基、1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル基、1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル基、1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル基、1-フェニル-3-ピラゾリル基、5-フェニル-3-ピラゾリル基、5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル基、5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル基、4-フェニル-2-チアゾリル基、5-フェニル-2-チアゾリル基、3-フェニル-5-イソオキサゾリル基、5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル基、5-フェニル-3-ピリジル基、2-フェニル-4-ピリジル基、5-ベンゾイル-2-ピリジル基、5-  
10 -(2-メチル-1-プロベニル)-2-ピラジニル基、5-フェニル-2-ピラジニル基、5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル基、5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル基、5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル基、5-ベンゾイル-2-ピラジニル基、4-フェニル-2-ピリミジニル基、5-フェニル-2-ピリミジニル基、2-フェニル-4-ピリミジニル基、  
20 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル基、5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル基、5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル基、2-ベンゾチアゾリル基、4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル基、6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル基、4-メチル-2-ベ

ンゾチアゾリル基、6-メトキシピリド[3, 2-d]チアゾール-2-イル基、6-メチル-2-キノリル基、7-メチル-2-キノリル基、7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル基等が好適である。

nは0又は1を意味するが、0が好適である。

- 5 T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味する。

- 10 「ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチン基」とは、無置換のメチン基又は置換基を有するメチン基を意味し、該置換基はハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択することができる。

該置換基のハロゲン原子としては、例えばフッ素原子、塩素原子等が好適である。

- 15 該置換基の低級アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基等が好適である。

該置換基の低級アルコキシ基としては、例えばメトキシ基、エトキシ基等が好適である。

該置換基としては、例えばハロゲン原子等が好適である。

- 20 T、U、V及びWの好ましい態様としては、例えば、T、U、V及びWが、それぞれ独立して、前記置換基、より好ましくはハロゲン原子を有していてもよいメチン基であるとき；又はT、U、V及びWのいずれか1つが窒素原子であるとき等が挙げられる。

- 25 Xは $-N(SO_2R^1)-$ 、 $-N(COR^2)-$ 又は $-CO-$ で表される基を意味し；Yは $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-O-$ 又は $-N(R^5)-$ で表される基を意味し； $R^1$ は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し； $R^2$ 及び $R^5$ は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し； $R^3$ 及び $R^4$ は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味する。



$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 及び $R^5$ の低級アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基等、より好ましくはメチル基等が好適である。

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 及び $R^5$ のアラルキル基としては、例えばベンジル基等が好適である。

- 5  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 及び $R^5$ のアリール基としては、例えばフェニル基等が好適である。

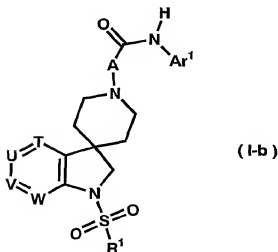
$R^1$ 及び $R^2$ としては、例えば低級アルキル基等が好適である。

$R^3$ 及び $R^4$ の好ましい態様としては、例えば、 $R^3$ 及び $R^4$ がともに水素原子であるとき等が挙げられる。

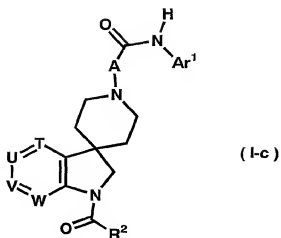
- 10  $R^5$ としては、例えば水素原子、低級アルキル基等、より好ましくは水素原子等が好適である。

X、Y及びnの好ましい態様としては、例えば、Xが $-N(SO_2R^1)-$ 若しくは $-N(COR^2)-$ で表される基、より好ましくは $-N(SO_2R^1)-$ で表される基であり、nが0であり、かつYが $-C(R^3)(R^4)-$ で表される基であるときか、又はXが $-CO-$ で表される基であり、かつYが $-O-$ 若しくは $-N(R^5)-$ で表される基、より好ましくは $-O-$ で表される基であるとき等が挙げられる。

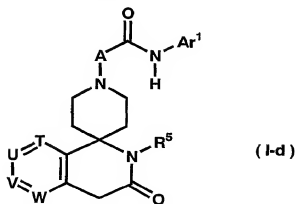
一般式 (I-b)



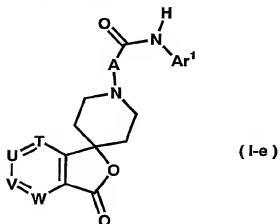
- 20 [式中、A、 $Ar^1$ 、 $R^1$ 、T、U、V及びWは前記の意味を有する]で表される化合物、一般式 (I-c)



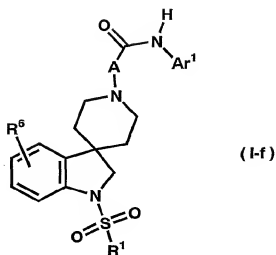
〔式中、A、Ar<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、T、U、V及びWは前記の意味を有する〕で表される化合物、一般式 (I-d)



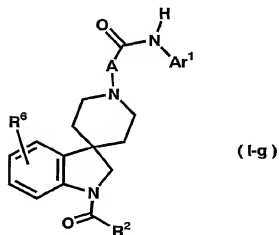
- 5 〔式中、A、Ar<sup>1</sup>、R<sup>5</sup>、T、U、V及びWは前記の意味を有する〕で表される化合物、一般式 (I-e)



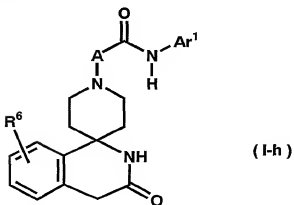
〔式中、A、Ar<sup>1</sup>、T、U、V及びWは前記の意味を有する〕で表される化合物、一般式 (I-f)



〔式中、 $R^1$ は水素原子又はハロゲン原子を意味し、 $A$ 、 $Ar^1$ 及び $R^1$ は前記の意味を有する〕で表される化合物、一般式 (I-g)

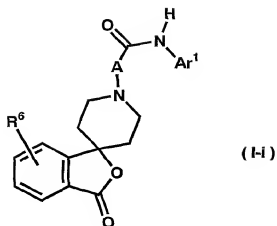


- 5 〔式中、 $A$ 、 $Ar^1$ 、 $R^2$ 及び $R^6$ は前記の意味を有する〕で表される化合物、一般式 (I-h)



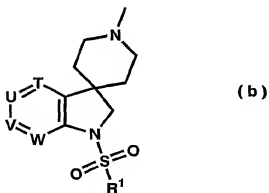
〔式中、 $A$ 、 $Ar^1$ 及び $R^6$ は前記の意味を有する〕で表される化合物及び一般式

(I - i)

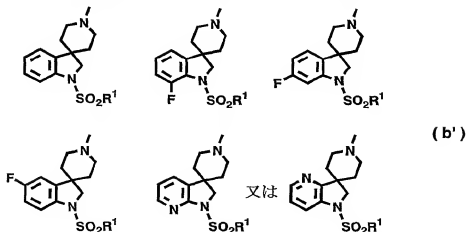


〔式中、A、Ar<sup>1</sup>及びR<sup>6</sup>は前記の意味を有する〕で表される化合物は一般式（I）で表される化合物に包含される。

5 式 (b)

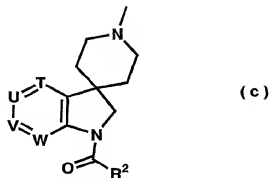


で表される基の具体例としては、例えば、次の式（b'）

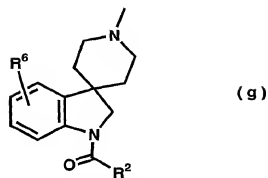


〔式中、R<sup>1</sup>は前記の意味を有する〕で表される基等が挙げられる。

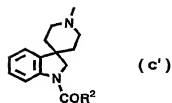
式 (c)



で表される基又は式 (g)

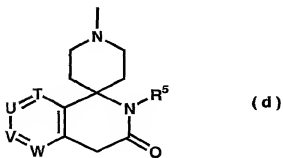


5 で表される基の具体例としては、例えば、次の式 (c') )

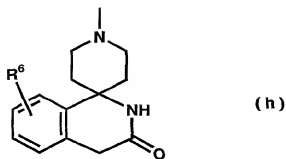


[式中、R²は前記の意味を有する] で表される基等が挙げられる。

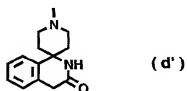
式 (d)



10 で表される基又は式 (h)

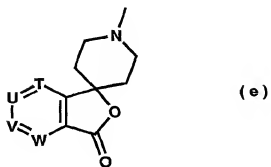


で表される基の具体例としては、例えば、次の式 (d')

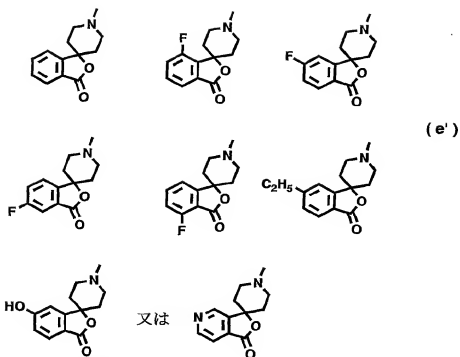


で表される基等が挙げられる。

5 式 (e)

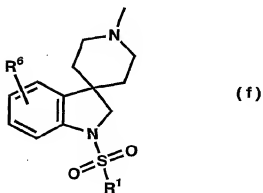


で表される基の具体例としては、例えば、次の式 (e')

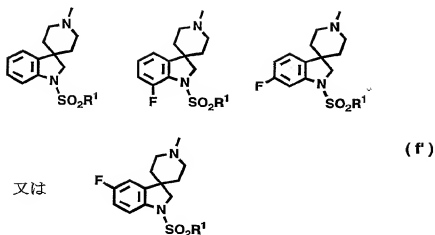


で表される基等が挙げられる。

式 (f)



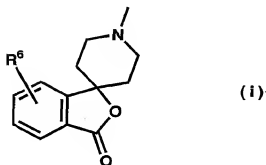
5 で表される基の具体例としては、例えば、次の式 (f')



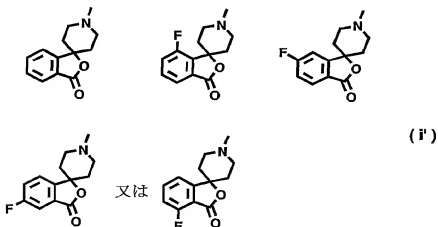
又は

〔式中、 $\text{R}^1$ は前記の意味を有する〕で表される基等が挙げられる。

式 (i)



5 で表される基の具体例としては、例えば、次の式 (i')



で表される基等が挙げられる。

本発明の化合物は、その置換基の態様によって、光学異性体、ジアステレオ異性体、幾何異性体等の立体異性体又は互変異性体が存在する場合があるが、本発明の化合物はこれら全ての立体異性体、互変異性体及びそれらの混合物をも包含



する。

本発明化合物の種々の結晶、水和物及び溶媒和物も本発明の範囲に属する。

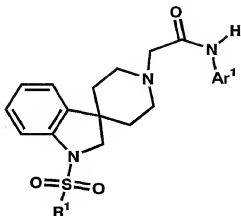
更に本発明化合物のプロドラッグもまた本発明の範囲に属する。一般的に、そのようなプロドラッグは、生体内で必要とされる化合物に容易に変換されうる本

- 5 発明化合物の機能的誘導体である。したがって、本発明に係る各種疾患の処置方法においては、「投与」という言葉は、特定した化合物の投与のみならず、患者に投与した後、生体内で当該特定した化合物に変換される化合物の投与を含む。適当なプロドラッグ誘導体の選択及び製造のための常套手段は、例えば “Design of Prodrugs” ed. H. Bundgaard, Elsevier, 1985等に記載され、ここに引用してその記載全体を本願明細書の一部となす。これらの化合物の代謝物は、本発明化合物を生物学的環境に置くことによって産生される活性化化合物を含み、本発明の範囲に属する。
- 10

一般式(I)で表される化合物の具体例としては、例えば以下の表の化合物が挙げられる。

- 15    なお、表中、Meはメチル基を、Etはエチル基を、Phはフェニル基を意味する。

表 1



No.	R1	Ar 1
1	Me	3-フルオロフェニル
2	Me	4-フルオロフェニル
3	Me	3, 4-ジフルオロフェニル
4	Me	3-クロロフェニル
5	Me	4-クロロフェニル
6	Me	3, 4-ジクロロフェニル
7	Me	4-アセチルフェニル
8	Me	5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
9	Me	4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
10	Me	2-ピフェニル
11	Me	3-ピフェニル
12	Me	4-ピフェニル
13	Me	4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
14	Me	4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
15	Me	4-(2-チアゾリル) フェニル
16	Me	4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
17	Me	3-(2-ピリジル) フェニル
18	Me	3-(4-ピリジル) フェニル
19	Me	4-(2-ピリジル) フェニル
20	Me	4-(3-ピリジル) フェニル
21	Me	4-(4-ピリジル) フェニル
22	Me	4-(2-エチル-4-ピリジル) フェニル
23	Me	4-(4-ピリミジニル) フェニル
24	Me	4-ベンゾイルフェニル
25	Me	4-(2-ピリジルカルボニル) フェニル
26	Me	1-ナフチル
27	Me	9-オキソ-3-フルオレニル
28	Me	1-メチル-2-イミダゾリル
29	Me	1-フェニル-4-イミダゾリル

(表1の続き)

30	Me	1-	(2-フルオロフェニル)	-4-イミダゾリル
31	Me	1-	(3-フルオロフェニル)	-4-イミダゾリル
32	Me	1-	(4-フルオロフェニル)	-4-イミダゾリル
33	Me	1-	(2, 3-ジフルオロフェニル)	-4-イミダゾリル
34	Me	1-	(2, 4-ジフルオロフェニル)	-4-イミダゾリル
35	Me	1-	(3, 5-ジフルオロフェニル)	-4-イミダゾリル
36	Me	1-	(3-クロロフェニル)	-4-イミダゾリル
37	Me	1-	(2-シアノフェニル)	-4-イミダゾリル
38	Me	1-	(3-シアノフェニル)	-4-イミダゾリル
39	Me	1-	(4-シアノフェニル)	-4-イミダゾリル
40	Me	1-	(3-トリフルオロメチルフェニル)	-4-イミダゾリル
41	Me	1-	[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]	-4-イミダゾリル
42	Me	1-	[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]	-4-イミダゾリル
43	Me	1-	(3-メトキシフェニル)	-4-イミダゾリル
44	Me	1-	(2-ジフルオロメトキシフェニル)	-4-イミダゾリル
45	Me	1-	(3-ジフルオロメトキシフェニル)	-4-イミダゾリル
46	Me	1-	(4-ジフルオロメトキシフェニル)	-4-イミダゾリル
47	Me	1-	(2-ピリジル)	-4-イミダゾリル
48	Me	1-	(4-ベンゾ [b] フラニル)	-4-イミダゾリル
49	Me	1-	(5-ベンゾ [b] フラニル)	-4-イミダゾリル
50	Me	1-	(7-ベンゾ [b] フラニル)	-4-イミダゾリル
51	Me	1-	(2-キノリル)	-4-イミダゾリル
52	Me	1-	(3-キノリル)	-4-イミダゾリル
53	Me	1-	(4-キノリル)	-4-イミダゾリル
54	Me	1-	(5-キノリル)	-4-イミダゾリル
55	Me	1-	(6-キノリル)	-4-イミダゾリル
56	Me	1-	(8-キノリル)	-4-イミダゾリル
57	Me	1-	フェニル-3-ピラゾリル	
58	Me	5-	フェニル-3-ピラゾリル	
59	Me	5-	(2-フルオロフェニル)	-3-ピラゾリル
60	Me	5-	(3-フルオロフェニル)	-3-ピラゾリル
61	Me	5-	(4-フルオロフェニル)	-3-ピラゾリル
62	Me	5-	(2-クロロフェニル)	-3-ピラゾリル
63	Me	5-	(3-クロロフェニル)	-3-ピラゾリル
64	Me	5-	(4-クロロフェニル)	-3-ピラゾリル
65	Me	5-	(3-メトキシフェニル)	-3-ピラゾリル
66	Me	5-	(2-ジフルオロメトキシフェニル)	-3-ピラゾリル
67	Me	5-	(3-ジフルオロメトキシフェニル)	-3-ピラゾリル
68	Me	2-	メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル	
69	Me	5-	(2-ピリジル)	-3-ピラゾリル

(表1の続き)

70	Me	5-	(5-メトキシ-3-ピリジル)	-	3-ピラゾリル
71	Me	5-	(2-キノリル)	-	3-ピラゾリル
72	Me	5-	(3-キノリル)	-	3-ピラゾリル
73	Me	2-	エチル-4-チアゾリル		
74	Me	4-	フェニル-2-チアゾリル		
75	Me	5-	フェニル-2-チアゾリル		
76	Me	5-	(3-クロロフェニル)	-	2-チアゾリル
77	Me	5-	(4-クロロフェニル)	-	2-チアゾリル
78	Me	5-	(4-メトキシフェニル)	-	2-チアゾリル
79	Me	5-	(2-ピリジル)	-	2-チアゾリル
80	Me	4-	フェニル-2-オキサゾリル		
81	Me	5-	フェニル-2-オキサゾリル		
82	Me	4-	(3-メトキシフェニル)	-	2-オキサゾリル
83	Me	4-	(2-フルオロメトキシフェニル)	-	2-オキサゾリル
84	Me	4-	(3-フルオロメトキシフェニル)	-	2-オキサゾリル
85	Me	3-	フェニル-5-イソオキサゾリル		
86	Me	3-	(2-クロロフェニル)	-	5-イソオキサゾリル
87	Me	3-	(3-クロロフェニル)	-	5-イソオキサゾリル
88	Me	3-	(4-クロロフェニル)	-	5-イソオキサゾリル
89	Me	3-	(2-ピリジル)	-	5-イソオキサゾリル
90	Me	5-	フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル		
91	Me	5-	フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル		
92	Me	5-	(3-クロロフェニル)	-	1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
93	Me	5-	(2-ピリジル)	-	1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
94	Me	5-	(2-エチル-4-ピリジル)	-	1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
95	Me	5-	フェニル-2-ピリジル		
96	Me	5-	フェニル-3-ピリジル		
97	Me	6-	フェニル-3-ピリジル		
98	Me	2-	フェニル-4-ピリジル		
99	Me	5-	(2-ピリジル)	-	2-ピリジル
100	Me	5-	ベンゾイル-2-ピリジル		
101	Me	6-	ベンゾイル-3-ピリジル		
102	Me	5-	クロロ-2-ピラジニル		
103	Me	5-	(1-メチルピニル)	-	2-ピラジニル
104	Me	5-	(2-メチル-1-プロペニル)	-	2-ピラジニル
105	Me	5-	アセチル-2-ピラジニル		
106	Me	5-	プロピオン-2-ピラジニル		
107	Me	5-	フェニル-2-ピラジニル		
108	Me	5-	(3-フルオロフェニル)	-	2-ピラジニル
109	Me	5-	(2-クロロフェニル)	-	2-ピラジニル

## (表 1 の続き)

110	Me	5-	(3-ヒドロキシフェニル)	-2-ピラジニル
111	Me	5-	(4-ヒドロキシフェニル)	-2-ピラジニル
112	Me	5-	(2-メトキシフェニル)	-2-ピラジニル
113	Me	5-	(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)	-2-ピラジニル
114	Me	5-	(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)	-2-ピラジニル
115	Me	5-	(2-ビリジル)	-2-ピラジニル
116	Me	5-	(3-ビリジル)	-2-ピラジニル
117	Me	5-	(5-ビリミジニル)	-2-ピラジニル
118	Me	5-	(3-キノリル)	-2-ピラジニル
119	Me	5-	ベンゾイル	-2-ピラジニル
120	Me	5-	(2-ビリジルカルボニル)	-2-ピラジニル
121	Me	5-	アセチル	-2-ビリミジニル
122	Me	5-	アセチル-3-メチル	-2-ビリミジニル
123	Me	4-	フェニル	-2-ビリミジニル
124	Me	5-	フェニル	-2-ビリミジニル
125	Me	2-	フェニル	-4-ビリミジニル
126	Me	6-	フェニル	-4-ビリミジニル
127	Me	2-	フェニル	-5-ビリミジニル
128	Me	5-	(2-フルオロフェニル)	-2-ビリミジニル
129	Me	5-	(3-フルオロフェニル)	-2-ビリミジニル
130	Me	5-	(4-フルオロフェニル)	-2-ビリミジニル
131	Me	5-	(2-クロロフェニル)	-2-ビリミジニル
132	Me	5-	(3-クロロフェニル)	-2-ビリミジニル
133	Me	5-	(4-クロロフェニル)	-2-ビリミジニル
134	Me	5-	(2-メチルフェニル)	-2-ビリミジニル
135	Me	5-	(3-メチルフェニル)	-2-ビリミジニル
136	Me	5-	(2-フルオロメチルフェニル)	-2-ビリミジニル
137	Me	5-	(3-フルオロメチルフェニル)	-2-ビリミジニル
138	Me	5-	(2-トリフルオロメチルフェニル)	-2-ビリミジニル
139	Me	5-	(3-トリフルオロメチルフェニル)	-2-ビリミジニル
140	Me	5-	(4-トリフルオロメチルフェニル)	-2-ビリミジニル
141	Me	5-	(2-ヒドロキシメチルフェニル)	-2-ビリミジニル
142	Me	5-	(3-ヒドロキシメチルフェニル)	-2-ビリミジニル
143	Me	5-	(2-ヒドロキシフェニル)	-2-ビリミジニル
144	Me	5-	(3-ヒドロキシフェニル)	-2-ビリミジニル
145	Me	5-	(2-メトキシフェニル)	-2-ビリミジニル
146	Me	5-	(3-メトキシフェニル)	-2-ビリミジニル
147	Me	5-	(4-メトキシフェニル)	-2-ビリミジニル
148	Me	5-	(2-フルオロメトキシフェニル)	-2-ビリミジニル
149	Me	5-	(3-フルオロメトキシフェニル)	-2-ビリミジニル

## (表 1 の続き)

- 150 Me 5- (2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
- 151 Me 5- (3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
- 152 Me 6-フェニル-3-ピリダジニル
- 153 Me 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
- 154 Me 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
- 155 Me 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
- 156 Me 2-ベンゾチアゾリル
- 157 Me 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
- 158 Me 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
- 159 Me 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
- 160 Me 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
- 161 Me 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
- 162 Me 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
- 163 Me 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
- 164 Me 6-メトキシ-7-アザベンゾチアゾール-2-イル
- 165 Me 3-キノリル
- 166 Me 6-キノリル
- 167 Me 6-メチル-2-キノリル
- 168 Me 7-メチル-2-キノリル
- 169 Me 8-メチル-2-キノリル
- 170 Me 2-メチル-6-キノリル
- 171 Me 6-クロロ-2-キノキサリニル
- 172 Me 7-クロロ-2-キノキサリニル
- 173 Me 6-メチル-2-キノキサリニル
- 174 Me 1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 175 Me 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 176 Me 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 177 Me 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 178 Me 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 179 Me 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 180 Et 3-フルオロフェニル
- 181 Et 4-フルオロフェニル
- 182 Et 3, 4-ジフルオロフェニル
- 183 Et 3-クロロフェニル
- 184 Et 4-クロロフェニル
- 185 Et 3, 4-ジクロロフェニル
- 186 Et 4-アセチルフェニル
- 187 Et 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
- 188 Et 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
- 189 Et 2-ピフェニル

(表 1 の続き)

- 190 Et 3-ビフェニル  
 191 Et 4-ビフェニル  
 192 Et 4- (1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル  
 193 Et 4- (1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル  
 194 Et 4- (2-チアゾリル) フェニル  
 195 Et 4- (2-エチル-4-チアゾリル) フェニル  
 196 Et 3- (2-ピリジル) フェニル  
 197 Et 3- (4-ピリジル) フェニル  
 198 Et 4- (2-ピリジル) フェニル  
 199 Et 4- (3-ピリジル) フェニル  
 200 Et 4- (4-ピリジル) フェニル  
 201 Et 4- (2-エチル-4-ピリジル) フェニル  
 202 Et 4- (4-ピリミジニル) フェニル  
 203 Et 4-ベンゾイルフェニル  
 204 Et 4- (2-ピリジルカルボニル) フェニル  
 205 Et 1-ナフチル  
 206 Et 9-オキソ-3-フルオレニル  
 207 Et 1-メチル-2-イミダゾリル  
 208 Et 1-フェニル-4-イミダゾリル  
 209 Et 1- (2-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
 210 Et 1- (3-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
 211 Et 1- (4-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
 212 Et 1- (2, 3-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
 213 Et 1- (2, 4-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
 214 Et 1- (3, 5-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
 215 Et 1- (3-クロロフェニル) -4-イミダゾリル  
 216 Et 1- (2-シアノフェニル) -4-イミダゾリル  
 217 Et 1- (3-シアノフェニル) -4-イミダゾリル  
 218 Et 1- (4-シアノフェニル) -4-イミダゾリル  
 219 Et 1- (3-トリフルオロメチルフェニル) -4-イミダゾリル  
 220 Et 1- [3- (2-ヒドロキシエチル) フェニル] -4-イミダゾリル  
 221 Et 1- [3- (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] -4-イミダゾリル  
 222 Et 1- (3-メトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
 223 Et 1- (2-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
 224 Et 1- (3-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
 225 Et 1- (4-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
 226 Et 1- (2-ピリジル) -4-イミダゾリル  
 227 Et 1- (4-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル  
 228 Et 1- (5-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル  
 229 Et 1- (7-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル

## (表 1 の続き)

230	Et	1-	(2-キノリル)	-4-イミダゾリル
231	Et	1-	(3-キノリル)	-4-イミダゾリル
232	Et	1-	(4-キノリル)	-4-イミダゾリル
233	Et	1-	(5-キノリル)	-4-イミダゾリル
234	Et	1-	(6-キノリル)	-4-イミダゾリル
235	Et	1-	(8-キノリル)	-4-イミダゾリル
236	Et	1-	フェニル-3-ピラゾリル	
237	Et	5-	フェニル-3-ピラゾリル	
238	Et	5-	(2-フルオロフェニル)	-3-ピラゾリル
239	Et	5-	(3-フルオロフェニル)	-3-ピラゾリル
240	Et	5-	(4-フルオロフェニル)	-3-ピラゾリル
241	Et	5-	(2-クロロフェニル)	-3-ピラゾリル
242	Et	5-	(3-クロロフェニル)	-3-ピラゾリル
243	Et	5-	(4-クロロフェニル)	-3-ピラゾリル
244	Et	5-	(3-メトキシフェニル)	-3-ピラゾリル
245	Et	5-	(2-ジフルオロメトキシフェニル)	-3-ピラゾリル
246	Et	5-	(3-ジフルオロメトキシフェニル)	-3-ピラゾリル
247	Et	2-	メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル	
248	Et	5-	(2-ビリジル)	-3-ピラゾリル
249	Et	5-	(5-メトキシ-3-ビリジル)	-3-ピラゾリル
250	Et	5-	(2-キノリル)	-3-ピラゾリル
251	Et	5-	(3-キノリル)	-3-ピラゾリル
252	Et	2-	エチル-4-チアゾリル	
253	Et	4-	フェニル-2-チアゾリル	
254	Et	5-	フェニル-2-チアゾリル	
255	Et	5-	(3-クロロフェニル)	-2-チアゾリル
256	Et	5-	(4-クロロフェニル)	-2-チアゾリル
257	Et	5-	(4-メトキシフェニル)	-2-チアゾリル
258	Et	5-	(2-ビリジル)	-2-チアゾリル
259	Et	4-	フェニル-2-オキサゾリル	
260	Et	5-	フェニル-2-オキサゾリル	
261	Et	4-	(3-メトキシフェニル)	-2-オキサゾリル
262	Et	4-	(2-フルオロメトキシフェニル)	-2-オキサゾリル
263	Et	4-	(3-フルオロメトキシフェニル)	-2-オキサゾリル
264	Et	3-	フェニル-5-イソオキサゾリル	
265	Et	3-	(2-クロロフェニル)	-5-イソオキサゾリル
266	Et	3-	(3-クロロフェニル)	-5-イソオキサゾリル
267	Et	3-	(4-クロロフェニル)	-5-イソオキサゾリル
268	Et	3-	(2-ビリジル)	-5-イソオキサゾリル
269	Et	5-	フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル	



(表 1 の続き)

270	Et	5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
271	Et	5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
272	Et	5-(2-ビリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
273	Et	5-(2-エチル-4-ビリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
274	Et	5-フェニル-2-ビリジル
275	Et	5-フェニル-3-ビリジル
276	Et	6-フェニル-3-ビリジル
277	Et	2-フェニル-4-ビリジル
278	Et	5-(2-ビリジル)-2-ビリジル
279	Et	5-ベンゾイル-2-ビリジル
280	Et	6-ベンゾイル-3-ビリジル
281	Et	5-クロロ-2-ピラジニル
282	Et	5-(1-メチルピニル)-2-ピラジニル
283	Et	5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル
284	Et	5-アセチル-2-ピラジニル
285	Et	5-プロピオニル-2-ピラジニル
286	Et	5-フェニル-2-ピラジニル
287	Et	5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル
288	Et	5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル
289	Et	5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
290	Et	5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
291	Et	5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル
292	Et	5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル
293	Et	5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル
294	Et	5-(2-ビリジル)-2-ピラジニル
295	Et	5-(3-ビリジル)-2-ピラジニル
296	Et	5-(5-ビリミジニル)-2-ピラジニル
297	Et	5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
298	Et	5-ベンゾイル-2-ピラジニル
299	Et	5-(2-ビリジルカルボニル)-2-ピラジニル
300	Et	5-アセチル-2-ビリミジニル
301	Et	5-アセチル-3-メチル-2-ビリミジニル
302	Et	4-フェニル-2-ビリミジニル
303	Et	5-フェニル-2-ビリミジニル
304	Et	2-フェニル-4-ビリミジニル
305	Et	6-フェニル-4-ビリミジニル
306	Et	2-フェニル-5-ビリミジニル
307	Et	5-(2-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
308	Et	5-(3-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
309	Et	5-(4-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル

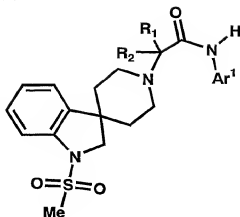
(表 1 の続き)

- 310 Et 5- (2-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル
- 311 Et 5- (3-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル
- 312 Et 5- (4-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル
- 313 Et 5- (2-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル
- 314 Et 5- (3-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル
- 315 Et 5- (2-フルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
- 316 Et 5- (3-フルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
- 317 Et 5- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
- 318 Et 5- (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
- 319 Et 5- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
- 320 Et 5- (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
- 321 Et 5- (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
- 322 Et 5- (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ビリミジニル
- 323 Et 5- (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ビリミジニル
- 324 Et 5- (2-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル
- 325 Et 5- (3-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル
- 326 Et 5- (4-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル
- 327 Et 5- (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-ビリミジニル
- 328 Et 5- (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-ビリミジニル
- 329 Et 5- (2-フルオロ-5-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル
- 330 Et 5- (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル
- 331 Et 6-フェニル-3-ビリダジニル
- 332 Et 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
- 333 Et 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
- 334 Et 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
- 335 Et 2-ベンゾチアゾリル
- 336 Et 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
- 337 Et 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
- 338 Et 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
- 339 Et 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
- 340 Et 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
- 341 Et 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
- 342 Et 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
- 343 Et 6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル
- 344 Et 3-キノリル
- 345 Et 6-キノリル
- 346 Et 6-メチル-2-キノリル
- 347 Et 7-メチル-2-キノリル
- 348 Et 8-メチル-2-キノリル
- 349 Et 2-メチル-6-キノリル

(表 1 の続き)

- 350 Et 6-クロロ-2-キノキサリニル  
351 Et 7-クロロ-2-キノキサリニル  
352 Et 6-メチル-2-キノキサリニル  
353 Et 1, 5-ナフチリジン-2-イル  
354 Et 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
355 Et 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
356 Et 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
357 Et 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
358 Et 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

表 2



No.	R1	R2	Ar 1
359	Me	H	3-フルオロフェニル
360	Me	H	4-フルオロフェニル
361	Me	H	3, 4-ジフルオロフェニル
362	Me	H	3-クロロフェニル
363	Me	H	4-クロロフェニル
364	Me	H	3, 4-ジクロロフェニル
365	Me	H	4-アセチルフェニル
366	Me	H	5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
367	Me	H	4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
368	Me	H	2-ピフェニル
369	Me	H	3-ピフェニル
370	Me	H	4-ピフェニル
371	Me	H	4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
372	Me	H	4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
373	Me	H	4-(2-チアゾリル) フェニル
374	Me	H	4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
375	Me	H	3-(2-ピリジル) フェニル
376	Me	H	3-(4-ピリジル) フェニル
377	Me	H	4-(2-ピリジル) フェニル
378	Me	H	4-(3-ピリジル) フェニル
379	Me	H	4-(4-ピリジル) フェニル

(表 2 の続き)

380	Me	H	4- (2-エチル-4-ビリジル) フェニル
381	Me	H	4- (4-ビリミジニル) フェニル
382	Me	H	4-ベンゾイルフェニル
383	Me	H	4- (2-ビリジルカルボニル) フェニル
384	Me	H	1-ナフチル
385	Me	H	9-オキソ-3-フルオレニル
386	Me	H	1-メチル-2-イミダゾリル
387	Me	H	1-フェニル-4-イミダゾリル
388	Me	H	1- (2-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
389	Me	H	1- (3-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
390	Me	H	1- (4-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
391	Me	H	1- (2, 3-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル
392	Me	H	1- (2, 4-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル
393	Me	H	1- (3, 5-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル
394	Me	H	1- (3-クロロフェニル) -4-イミダゾリル
395	Me	H	1- (2-シアノフェニル) -4-イミダゾリル
396	Me	H	1- (3-シアノフェニル) -4-イミダゾリル
397	Me	H	1- (4-シアノフェニル) -4-イミダゾリル
398	Me	H	1- (3-トリフルオロメチルフェニル) -4-イミダゾリル
399	Me	H	1- [3- (2-ヒドロキシエチル) フェニル] -4-イミダゾリル
400	Me	H	1- [3- (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] -4-イミダゾリル
401	Me	H	1- (3-メトキシフェニル) -4-イミダゾリル
402	Me	H	1- (2-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル
403	Me	H	1- (3-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル
404	Me	H	1- (4-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル
405	Me	H	1- (2-ビリジル) -4-イミダゾリル
406	Me	H	1- (4-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル
407	Me	H	1- (5-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル
408	Me	H	1- (7-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル
409	Me	H	1- (2-キノリル) -4-イミダゾリル
410	Me	H	1- (3-キノリル) -4-イミダゾリル
411	Me	H	1- (4-キノリル) -4-イミダゾリル
412	Me	H	1- (5-キノリル) -4-イミダゾリル
413	Me	H	1- (6-キノリル) -4-イミダゾリル
414	Me	H	1- (8-キノリル) -4-イミダゾリル
415	Me	H	1-フェニル-3-ピラゾリル
416	Me	H	5-フェニル-3-ピラゾリル
417	Me	H	5- (2-フルオロフェニル) -3-ピラゾリル
418	Me	H	5- (3-フルオロフェニル) -3-ピラゾリル
419	Me	H	5- (4-フルオロフェニル) -3-ピラゾリル

(表 2 の続き)

420	Me	H	5 - (2-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
421	Me	H	5 - (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
422	Me	H	5 - (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
423	Me	H	5 - (3-メトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
424	Me	H	5 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
425	Me	H	5 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
426	Me	H	2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
427	Me	H	5 - (2-ピリジル) - 3-ピラゾリル
428	Me	H	5 - (5-メトキシ-3-ピリジル) - 3-ピラゾリル
429	Me	H	5 - (2-キノリル) - 3-ピラゾリル
430	Me	H	5 - (3-キノリル) - 3-ピラゾリル
431	Me	H	2-エチル-4-チアゾリル
432	Me	H	4-フェニル-2-チアゾリル
433	Me	H	5-フェニル-2-チアゾリル
434	Me	H	5 - (3-クロロフェニル) - 2-チアゾリル
435	Me	H	5 - (4-クロロフェニル) - 2-チアゾリル
436	Me	H	5 - (4-メトキシフェニル) - 2-チアゾリル
437	Me	H	5 - (2-ピリジル) - 2-チアゾリル
438	Me	H	4-フェニル-2-オキサゾリル
439	Me	H	5-フェニル-2-オキサゾリル
440	Me	H	4 - (3-メトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
441	Me	H	4 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
442	Me	H	4 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
443	Me	H	3-フェニル-5-イソオキサゾリル
444	Me	H	3 - (2-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
445	Me	H	3 - (3-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
446	Me	H	3 - (4-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
447	Me	H	3 - (2-ピリジル) - 5-イソオキサゾリル
448	Me	H	5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
449	Me	H	5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
450	Me	H	5 - (3-クロロフェニル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
451	Me	H	5 - (2-ピリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
452	Me	H	5 - (2-エチル-4-ピリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
453	Me	H	5-フェニル-2-ピリジル
454	Me	H	5-フェニル-3-ピリジル
455	Me	H	6-フェニル-3-ピリジル
456	Me	H	2-フェニル-4-ピリジル
457	Me	H	5 - (2-ピリジル) - 2-ピリジル
458	Me	H	5-ベンゾイル-2-ピリジル
459	Me	H	6-ベンゾイル-3-ピリジル

## (表 2 の続き)

460	Me	H	5-クロロ-2-ピラジニル
461	Me	H	5-(1-メチルピニル)-2-ピラジニル
462	Me	H	5-(2-メチル-1-プロベニル)-2-ピラジニル
463	Me	H	5-アセチル-2-ピラジニル
464	Me	H	5-プロピオニル-2-ピラジニル
465	Me	H	5-フェニル-2-ピラジニル
466	Me	H	5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル
467	Me	H	5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル
468	Me	H	5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
469	Me	H	5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
470	Me	H	5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル
471	Me	H	5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル
472	Me	H	5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル
473	Me	H	5-(2-ビリジル)-2-ピラジニル
474	Me	H	5-(3-ビリジル)-2-ピラジニル
475	Me	H	5-(5-ビリミジニル)-2-ピラジニル
476	Me	H	5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
477	Me	H	5-ベンゾイル-2-ピラジニル
478	Me	H	5-(2-ビリジルカルボニル)-2-ピラジニル
479	Me	H	5-アセチル-2-ビリミジニル
480	Me	H	5-アセチル-3-メチル-2-ビリミジニル
481	Me	H	4-フェニル-2-ビリミジニル
482	Me	H	5-フェニル-2-ビリミジニル
483	Me	H	2-フェニル-4-ビリミジニル
484	Me	H	6-フェニル-4-ビリミジニル
485	Me	H	2-フェニル-5-ビリミジニル
486	Me	H	5-(2-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
487	Me	H	5-(3-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
488	Me	H	5-(4-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
489	Me	H	5-(2-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
490	Me	H	5-(3-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
491	Me	H	5-(4-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
492	Me	H	5-(2-メチルフェニル)-2-ビリミジニル
493	Me	H	5-(3-メチルフェニル)-2-ビリミジニル
494	Me	H	5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
495	Me	H	5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
496	Me	H	5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
497	Me	H	5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
498	Me	H	5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
499	Me	H	5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ビリミジニル

## (表 2 の続き)

500	Me	H	5- (3-ヒドロキシメチルフェニル) -2-ピリミジニル
501	Me	H	5- (2-ヒドロキシフェニル) -2-ピリミジニル
502	Me	H	5- (3-ヒドロキシフェニル) -2-ピリミジニル
503	Me	H	5- (2-メトキシフェニル) -2-ピリミジニル
504	Me	H	5- (3-メトキシフェニル) -2-ピリミジニル
505	Me	H	5- (4-メトキシフェニル) -2-ピリミジニル
506	Me	H	5- (2-フルオロメトキシフェニル) -2-ピリミジニル
507	Me	H	5- (3-フルオロメトキシフェニル) -2-ピリミジニル
508	Me	H	5- (2-フルオロ-5-メチルフェニル) -2-ピリミジニル
509	Me	H	5- (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) -2-ピリミジニル
510	Me	H	6-フェニル-3-ピリダジニル
511	Me	H	6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
512	Me	H	5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
513	Me	H	4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
514	Me	H	2-ベンゾチアゾリル
515	Me	H	5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
516	Me	H	4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
517	Me	H	6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
518	Me	H	4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
519	Me	H	2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
520	Me	H	4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
521	Me	H	5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
522	Me	H	6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル
523	Me	H	3-キノリル
524	Me	H	6-キノリル
525	Me	H	6-メチル-2-キノリル
526	Me	H	7-メチル-2-キノリル
527	Me	H	8-メチル-2-キノリル
528	Me	H	2-メチル-6-キノリル
529	Me	H	6-クロロ-2-キノキサリニル
530	Me	H	7-クロロ-2-キノキサリニル
531	Me	H	6-メチル-2-キノキサリニル
532	Me	H	1, 5-ナフチリジン-2-イル
533	Me	H	7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
534	Me	H	7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
535	Me	H	7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
536	Me	H	7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
537	Me	H	7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
538	Et	H	3-フルオロフェニル
539	Et	H	4-フルオロフェニル



## (表 2 の続き)

540 Et H	3, 4-ジフルオロフェニル
541 Et H	3-クロロフェニル
542 Et H	4-クロロフェニル
543 Et H	3, 4-ジクロロフェニル
544 Et H	4-アセチルフェニル
545 Et H	5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
546 Et H	4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
547 Et H	2-ビフェニル
548 Et H	3-ビフェニル
549 Et H	4-ビフェニル
550 Et H	4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
551 Et H	4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
552 Et H	4-(2-チアゾリル) フェニル
553 Et H	4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
554 Et H	3-(2-ピリジル) フェニル
555 Et H	3-(4-ピリジル) フェニル
556 Et H	4-(2-ピリジル) フェニル
557 Et H	4-(3-ピリジル) フェニル
558 Et H	4-(4-ピリジル) フェニル
559 Et H	4-(2-エチル-4-ピリジル) フェニル
560 Et H	4-(4-ピリミジニル) フェニル
561 Et H	4-ベンゾイルフェニル
562 Et H	4-(2-ピリジルカルボニル) フェニル
563 Et H	1-ナフチル
564 Et H	9-オキソ-3-フルオレニル
565 Et H	1-メチル-2-イミダゾリル
566 Et H	1-フェニル-4-イミダゾリル
567 Et H	1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
568 Et H	1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
569 Et H	1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
570 Et H	1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
571 Et H	1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
572 Et H	1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
573 Et H	1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル
574 Et H	1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
575 Et H	1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
576 Et H	1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
577 Et H	1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル
578 Et H	1-[3-(2-ヒドロキシエチル) フェニル]-4-イミダゾリル
579 Et H	1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル]-4-イミダゾリル

## (表 2 の続き)

580	E <sup>1</sup>	H	1-	(3-メトキシフェニル)	-4-イミダゾリル
581	E <sup>1</sup>	H	1-	(2-ジフルオロメトキシフェニル)	-4-イミダゾリル
582	E <sup>1</sup>	H	1-	(3-ジフルオロメトキシフェニル)	-4-イミダゾリル
583	E <sup>1</sup>	H	1-	(4-ジフルオロメトキシフェニル)	-4-イミダゾリル
584	E <sup>1</sup>	H	1-	(2-ピリジル)	-4-イミダゾリル
585	E <sup>1</sup>	H	1-	(4-ベンゾ [b] フラニル)	-4-イミダゾリル
586	E <sup>1</sup>	H	1-	(5-ベンゾ [b] フラニル)	-4-イミダゾリル
587	E <sup>1</sup>	H	1-	(7-ベンゾ [b] フラニル)	-4-イミダゾリル
588	E <sup>1</sup>	H	1-	(2-キノリル)	-4-イミダゾリル
589	E <sup>1</sup>	H	1-	(3-キノリル)	-4-イミダゾリル
590	E <sup>1</sup>	H	1-	(4-キノリル)	-4-イミダゾリル
591	E <sup>1</sup>	H	1-	(5-キノリル)	-4-イミダゾリル
592	E <sup>1</sup>	H	1-	(6-キノリル)	-4-イミダゾリル
593	E <sup>1</sup>	H	1-	(8-キノリル)	-4-イミダゾリル
594	E <sup>1</sup>	H	1-	フェニル-3-ピラゾリル	
595	E <sup>1</sup>	H	5-	フェニル-3-ピラゾリル	
596	E <sup>1</sup>	H	5-	(2-フルオロフェニル)	-3-ピラゾリル
597	E <sup>1</sup>	H	5-	(3-フルオロフェニル)	-3-ピラゾリル
598	E <sup>1</sup>	H	5-	(4-フルオロフェニル)	-3-ピラゾリル
599	E <sup>1</sup>	H	5-	(2-クロロフェニル)	-3-ピラゾリル
600	E <sup>1</sup>	H	5-	(3-クロロフェニル)	-3-ピラゾリル
601	E <sup>1</sup>	H	5-	(4-クロロフェニル)	-3-ピラゾリル
602	E <sup>1</sup>	H	5-	(3-メトキシフェニル)	-3-ピラゾリル
603	E <sup>1</sup>	H	5-	(2-ジフルオロメトキシフェニル)	-3-ピラゾリル
604	E <sup>1</sup>	H	5-	(3-ジフルオロメトキシフェニル)	-3-ピラゾリル
605	E <sup>1</sup>	H	2-	メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル	
606	E <sup>1</sup>	H	5-	(2-ピリジル)	-3-ピラゾリル
607	E <sup>1</sup>	H	5-	(5-メトキシ-3-ピリジル)	-3-ピラゾリル
608	E <sup>1</sup>	H	5-	(2-キノリル)	-3-ピラゾリル
609	E <sup>1</sup>	H	5-	(3-キノリル)	-3-ピラゾリル
610	E <sup>1</sup>	H	2-	エチル-4-チアゾリル	
611	E <sup>1</sup>	H	4-	フェニル-2-チアゾリル	
612	E <sup>1</sup>	H	5-	フェニル-2-チアゾリル	
613	E <sup>1</sup>	H	5-	(3-クロロフェニル)	-2-チアゾリル
614	E <sup>1</sup>	H	5-	(4-クロロフェニル)	-2-チアゾリル
615	E <sup>1</sup>	H	5-	(4-メトキシフェニル)	-2-チアゾリル
616	E <sup>1</sup>	H	5-	(2-ピリジル)	-2-チアゾリル
617	E <sup>1</sup>	H	4-	フェニル-2-オキサゾリル	
618	E <sup>1</sup>	H	5-	フェニル-2-オキサゾリル	
619	E <sup>1</sup>	H	4-	(3-メトキシフェニル)	-2-オキサゾリル

(表2の続き)

620	Et	H	4- (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
621	Et	H	4- (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
622	Et	H	3-フェニル-5-イソオキサゾリル
623	Et	H	3- (2-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
624	Et	H	3- (3-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
625	Et	H	3- (4-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
626	Et	H	3- (2-ビリジル) - 5-イソオキサゾリル
627	Et	H	5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
628	Et	H	5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
629	Et	H	5- (3-クロロフェニル) -1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
630	Et	H	5- (2-ビリジル) -1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
631	Et	H	5- (2-エチル-4-ビリジル) -1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
632	Et	H	5-フェニル-2-ビリジル
633	Et	H	5-フェニル-3-ビリジル
634	Et	H	6-フェニル-3-ビリジル
635	Et	H	2-フェニル-4-ビリジル
636	Et	H	5- (2-ビリジル) -2-ビリジル
637	Et	H	5-ベンゾイル-2-ビリジル
638	Et	H	6-ベンゾイル-3-ビリジル
639	Et	H	5-クロロ-2-ピラジニル
640	Et	H	5- (1-メチルピニル) -2-ピラジニル
641	Et	H	5- (2-メチル-1-プロペニル) -2-ピラジニル
642	Et	H	5-アセチル-2-ピラジニル
643	Et	H	5-プロピオニル-2-ピラジニル
644	Et	H	5-フェニル-2-ピラジニル
645	Et	H	5- (3-フルオロフェニル) -2-ピラジニル
646	Et	H	5- (2-クロロフェニル) -2-ピラジニル
647	Et	H	5- (3-ヒドロキシフェニル) -2-ピラジニル
648	Et	H	5- (4-ヒドロキシフェニル) -2-ピラジニル
649	Et	H	5- (2-メトキシフェニル) -2-ピラジニル
650	Et	H	5- (1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル) -2-ピラジニル
651	Et	H	5- (1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル) -2-ピラジニル
652	Et	H	5- (2-ビリジル) -2-ピラジニル
653	Et	H	5- (3-ビリジル) -2-ピラジニル
654	Et	H	5- (5-ビリミジニル) -2-ピラジニル
655	Et	H	5- (3-キノリル) -2-ピラジニル
656	Et	H	5-ベンゾイル-2-ピラジニル
657	Et	H	5- (2-ビリジルカルボニル) -2-ピラジニル
658	Et	H	5-アセチル-2-ビリミジニル
659	Et	H	5-アセチル-3-メチル-2-ビリミジニル

## (表 2 の続き)

660	Et	H	4-フェニル-2-ビリミジニル
661	Et	H	5-フェニル-2-ビリミジニル
662	Et	H	2-フェニル-4-ビリミジニル
663	Et	H	6-フェニル-4-ビリミジニル
664	Et	H	2-フェニル-5-ビリミジニル
665	Et	H	5-(2-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
666	Et	H	5-(3-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
667	Et	H	5-(4-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
668	Et	H	5-(2-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
669	Et	H	5-(3-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
670	Et	H	5-(4-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
671	Et	H	5-(2-メチルフェニル)-2-ビリミジニル
672	Et	H	5-(3-メチルフェニル)-2-ビリミジニル
673	Et	H	5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
674	Et	H	5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
675	Et	H	5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
676	Et	H	5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
677	Et	H	5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
678	Et	H	5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ビリミジニル
679	Et	H	5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ビリミジニル
680	Et	H	5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ビリミジニル
681	Et	H	5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ビリミジニル
682	Et	H	5-(2-メトキシフェニル)-2-ビリミジニル
683	Et	H	5-(3-メトキシフェニル)-2-ビリミジニル
684	Et	H	5-(4-メトキシフェニル)-2-ビリミジニル
685	Et	H	5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ビリミジニル
686	Et	H	5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ビリミジニル
687	Et	H	5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ビリミジニル
688	Et	H	5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ビリミジニル
689	Et	H	6-フェニル-3-ビリダジニル
690	Et	H	6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
691	Et	H	5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
692	Et	H	4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
693	Et	H	2-ベンゾチアゾリル
694	Et	H	5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
695	Et	H	4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
696	Et	H	6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
697	Et	H	4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
698	Et	H	2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
699	Et	H	4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル

## (表2の続き)

700	Et	H	5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
701	Et	H	6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル
702	Et	H	3-キノリル
703	Et	H	6-キノリル
704	Et	H	6-メチル-2-キノリル
705	Et	H	7-メチル-2-キノリル
706	Et	H	8-メチル-2-キノリル
707	Et	H	2-メチル-6-キノリル
708	Et	H	6-クロロ-2-キノキサリニル
709	Et	H	7-クロロ-2-キノキサリニル
710	Et	H	6-メチル-2-キノキサリニル
711	Et	H	1, 5-ナフチリジン-2-イル
712	Et	H	7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
713	Et	H	7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
714	Et	H	7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
715	Et	H	7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
716	Et	H	7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
717	Ph	H	3-フルオロフェニル
718	Ph	H	4-フルオロフェニル
719	Ph	H	3, 4-ジフルオロフェニル
720	Ph	H	3-クロロフェニル
721	Ph	H	4-クロロフェニル
722	Ph	H	3, 4-ジクロロフェニル
723	Ph	H	4-アセチルフェニル
724	Ph	H	5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
725	Ph	H	4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
726	Ph	H	2-ビフェニル
727	Ph	H	3-ビフェニル
728	Ph	H	4-ビフェニル
729	Ph	H	4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
730	Ph	H	4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
731	Ph	H	4-(2-チアゾリル) フェニル
732	Ph	H	4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
733	Ph	H	3-(2-ピリジル) フェニル
734	Ph	H	3-(4-ピリジル) フェニル
735	Ph	H	4-(2-ピリジル) フェニル
736	Ph	H	4-(3-ピリジル) フェニル
737	Ph	H	4-(4-ピリジル) フェニル
738	Ph	H	4-(2-エチル-4-ピリジル) フェニル
739	Ph	H	4-(4-ピリミジニル) フェニル

## (表 2 の続き)

740	Ph	H	4-ベンゾイルフェニル
741	Ph	H	4-(2-ビリジルカルボニル) フェニル
742	Ph	H	1-ナフチル
743	Ph	H	9-オキソ-3-フルオレニル
744	Ph	H	1-メチル-2-イミダゾリル
745	Ph	H	1-フェニル-4-イミダゾリル
746	Ph	H	1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
747	Ph	H	1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
748	Ph	H	1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
749	Ph	H	1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
750	Ph	H	1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
751	Ph	H	1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
752	Ph	H	1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル
753	Ph	H	1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
754	Ph	H	1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
755	Ph	H	1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
756	Ph	H	1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル
757	Ph	H	1-[3-(2-ヒドロキシエチル) フェニル]-4-イミダゾリル
758	Ph	H	1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル]-4-イミダゾリル
759	Ph	H	1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル
760	Ph	H	1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
761	Ph	H	1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
762	Ph	H	1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
763	Ph	H	1-(2-ビリジル)-4-イミダゾリル
764	Ph	H	1-(4-ベンゾ [b] フラニル)-4-イミダゾリル
765	Ph	H	1-(5-ベンゾ [b] フラニル)-4-イミダゾリル
766	Ph	H	1-(7-ベンゾ [b] フラニル)-4-イミダゾリル
767	Ph	H	1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル
768	Ph	H	1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル
769	Ph	H	1-(4-キノリル)-4-イミダゾリル
770	Ph	H	1-(5-キノリル)-4-イミダゾリル
771	Ph	H	1-(6-キノリル)-4-イミダゾリル
772	Ph	H	1-(8-キノリル)-4-イミダゾリル
773	Ph	H	1-フェニル-3-ピラゾリル
774	Ph	H	5-フェニル-3-ピラゾリル
775	Ph	H	5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
776	Ph	H	5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
777	Ph	H	5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
778	Ph	H	5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
779	Ph	H	5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル

## (表 2 の続き)

780	Ph	H	5 - (4-クロロフェニル) - 3-ビラゾリル
781	Ph	H	5 - (3-メトキシフェニル) - 3-ビラゾリル
782	Ph	H	5 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ビラゾリル
783	Ph	H	5 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ビラゾリル
784	Ph	H	2-メチル-5-フェニル-3-ビラゾリル
785	Ph	H	5 - (2-ピリジル) - 3-ビラゾリル
786	Ph	H	5 - (5-メトキシ-3-ピリジル) - 3-ビラゾリル
787	Ph	H	5 - (2-キノリル) - 3-ビラゾリル
788	Ph	H	5 - (3-キノリル) - 3-ビラゾリル
789	Ph	H	2-エチル-4-チアゾリル
790	Ph	H	4-フェニル-2-チアゾリル
791	Ph	H	5-フェニル-2-チアゾリル
792	Ph	H	5 - (3-クロロフェニル) - 2-チアゾリル
793	Ph	H	5 - (4-クロロフェニル) - 2-チアゾリル
794	Ph	H	5 - (4-メトキシフェニル) - 2-チアゾリル
795	Ph	H	5 - (2-ピリジル) - 2-チアゾリル
796	Ph	H	4-フェニル-2-オキサゾリル
797	Ph	H	5-フェニル-2-オキサゾリル
798	Ph	H	4 - (3-メトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
799	Ph	H	4 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
800	Ph	H	4 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
801	Ph	H	3-フェニル-5-イソオキサゾリル
802	Ph	H	3 - (2-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
803	Ph	H	3 - (3-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
804	Ph	H	3 - (4-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
805	Ph	H	3 - (2-ピリジル) - 5-イソオキサゾリル
806	Ph	H	5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
807	Ph	H	5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
808	Ph	H	5 - (3-クロロフェニル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
809	Ph	H	5 - (2-ピリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
810	Ph	H	5 - (2-エチル-4-ピリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
811	Ph	H	5-フェニル-2-ピリジル
812	Ph	H	5-フェニル-3-ピリジル
813	Ph	H	6-フェニル-3-ピリジル
814	Ph	H	2-フェニル-4-ピリジル
815	Ph	H	5 - (2-ピリジル) - 2-ピリジル
816	Ph	H	5-ベンゾイル-2-ピリジル
817	Ph	H	6-ベンゾイル-3-ピリジル
818	Ph	H	5-クロロ-2-ピラジニル
819	Ph	H	5 - (1-メチルピニル) - 2-ピラジニル

(表 2 の続き)

820	Ph	H	5 - (2-メチル-1-プロベニル) - 2-ビラジニル
821	Ph	H	5-アセチル-2-ビラジニル
822	Ph	H	5-プロピオニル-2-ビラジニル
823	Ph	H	5-フェニル-2-ビラジニル
824	Ph	H	5 - (3-フルオロフェニル) - 2-ビラジニル
825	Ph	H	5 - (2-クロロフェニル) - 2-ビラジニル
826	Ph	H	5 - (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ビラジニル
827	Ph	H	5 - (4-ヒドロキシフェニル) - 2-ビラジニル
828	Ph	H	5 - (2-メトキシフェニル) - 2-ビラジニル
829	Ph	H	5 - (1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル) - 2-ビラジニル
830	Ph	H	5 - (1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル) - 2-ビラジニル
831	Ph	H	5 - (2-ビリジル) - 2-ビラジニル
832	Ph	H	5 - (3-ビリジル) - 2-ビラジニル
833	Ph	H	5 - (5-ビリミジニル) - 2-ビラジニル
834	Ph	H	5 - (3-キノリル) - 2-ビラジニル
835	Ph	H	5-ベンゾイル-2-ビラジニル
836	Ph	H	5 - (2-ビリジルカルボニル) - 2-ビラジニル
837	Ph	H	5-アセチル-2-ビリミジニル
838	Ph	H	5-アセチル-3-メチル-2-ビリミジニル
839	Ph	H	4-フェニル-2-ビリミジニル
840	Ph	H	5-フェニル-2-ビリミジニル
841	Ph	H	2-フェニル-4-ビリミジニル
842	Ph	H	6-フェニル-4-ビリミジニル
843	Ph	H	2-フェニル-5-ビリミジニル
844	Ph	H	5 - (2-フルオロフェニル) - 2-ビリミジニル
845	Ph	H	5 - (3-フルオロフェニル) - 2-ビリミジニル
846	Ph	H	5 - (4-フルオロフェニル) - 2-ビリミジニル
847	Ph	H	5 - (2-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル
848	Ph	H	5 - (3-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル
849	Ph	H	5 - (4-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル
850	Ph	H	5 - (2-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル
851	Ph	H	5 - (3-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル
852	Ph	H	5 - (2-フルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
853	Ph	H	5 - (3-フルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
854	Ph	H	5 - (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
855	Ph	H	5 - (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
856	Ph	H	5 - (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
857	Ph	H	5 - (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
858	Ph	H	5 - (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
859	Ph	H	5 - (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ビリミジニル



## (表 2 の続き)

860	Ph	H	5- (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル
861	Ph	H	5- (2-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
862	Ph	H	5- (3-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
863	Ph	H	5- (4-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
864	Ph	H	5- (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
865	Ph	H	5- (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
866	Ph	H	5- (2-フルオロ-5-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル
867	Ph	H	5- (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
868	Ph	H	6-フェニル-3-ピリダジニル
869	Ph	H	6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
870	Ph	H	5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
871	Ph	H	4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
872	Ph	H	2-ベンゾチアゾリル
873	Ph	H	5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
874	Ph	H	4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
875	Ph	H	6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
876	Ph	H	4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
877	Ph	H	2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
878	Ph	H	4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
879	Ph	H	5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
880	Ph	H	6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル
881	Ph	H	3-キノリル
882	Ph	H	6-キノリル
883	Ph	H	6-メチル-2-キノリル
884	Ph	H	7-メチル-2-キノリル
885	Ph	H	8-メチル-2-キノリル
886	Ph	H	2-メチル-6-キノリル
887	Ph	H	6-クロロ-2-キノキサリニル
888	Ph	H	7-クロロ-2-キノキサリニル
889	Ph	H	6-メチル-2-キノキサリニル
890	Ph	H	1, 5-ナフチリジン-2-イル
891	Ph	H	7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
892	Ph	H	7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
893	Ph	H	7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
894	Ph	H	7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
895	Ph	H	7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
896	Me	Me	3-フルオロフェニル
897	Me	Me	4-フルオロフェニル
898	Me	Me	3, 4-ジフルオロフェニル
899	Me	Me	3-クロロフェニル

## (表2の続き)

900	Me	Me	4-クロロフェニル
901	Me	Me	3, 4-ジクロロフェニル
902	Me	Me	4-アセチルフェニル
903	Me	Me	5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
904	Me	Me	4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
905	Me	Me	2-ビフェニル
906	Me	Me	3-ビフェニル
907	Me	Me	4-ビフェニル
908	Me	Me	4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
909	Me	Me	4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
910	Me	Me	4-(2-チアゾリル) フェニル
911	Me	Me	4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
912	Me	Me	3-(2-ビリジル) フェニル
913	Me	Me	3-(4-ビリジル) フェニル
914	Me	Me	4-(2-ビリジル) フェニル
915	Me	Me	4-(3-ビリジル) フェニル
916	Me	Me	4-(4-ビリジル) フェニル
917	Me	Me	4-(2-エチル-4-ビリジル) フェニル
918	Me	Me	4-(4-ビリミジニル) フェニル
919	Me	Me	4-ベンゾイルフェニル
920	Me	Me	4-(2-ビリジルカルボニル) フェニル
921	Me	Me	1-ナフチル
922	Me	Me	9-オキソ-3-フルオレニル
923	Me	Me	1-メチル-2-イミダゾリル
924	Me	Me	1-フェニル-4-イミダゾリル
925	Me	Me	1-(2-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
926	Me	Me	1-(3-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
927	Me	Me	1-(4-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
928	Me	Me	1-(2, 3-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル
929	Me	Me	1-(2, 4-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル
930	Me	Me	1-(3, 5-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル
931	Me	Me	1-(3-クロロフェニル) -4-イミダゾリル
932	Me	Me	1-(2-シアノフェニル) -4-イミダゾリル
933	Me	Me	1-(3-シアノフェニル) -4-イミダゾリル
934	Me	Me	1-(4-シアノフェニル) -4-イミダゾリル
935	Me	Me	1-(3-トリフルオロメチルフェニル) -4-イミダゾリル
936	Me	Me	1-[3-(2-ヒドロキシエチル) フェニル] -4-イミダゾリル
937	Me	Me	1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] -4-イミダゾリル
938	Me	Me	1-(3-メトキシフェニル) -4-イミダゾリル
939	Me	Me	1-(2-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル

## (表 2 の続き)

940	Me	Me	1 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
941	Me	Me	1 - (4-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
942	Me	Me	1 - (2-ピリジル) - 4-イミダゾリル
943	Me	Me	1 - (4-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル
944	Me	Me	1 - (5-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル
945	Me	Me	1 - (7-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル
946	Me	Me	1 - (2-キノリル) - 4-イミダゾリル
947	Me	Me	1 - (3-キノリル) - 4-イミダゾリル
948	Me	Me	1 - (4-キノリル) - 4-イミダゾリル
949	Me	Me	1 - (5-キノリル) - 4-イミダゾリル
950	Me	Me	1 - (6-キノリル) - 4-イミダゾリル
951	Me	Me	1 - (8-キノリル) - 4-イミダゾリル
952	Me	Me	1-フェニル-3-ピラゾリル
953	Me	Me	5-フェニル-3-ピラゾリル
954	Me	Me	5 - (2-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
955	Me	Me	5 - (3-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
956	Me	Me	5 - (4-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
957	Me	Me	5 - (2-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
958	Me	Me	5 - (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
959	Me	Me	5 - (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
960	Me	Me	5 - (3-メトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
961	Me	Me	5 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
962	Me	Me	5 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
963	Me	Me	2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
964	Me	Me	5 - (2-ピリジル) - 3-ピラゾリル
965	Me	Me	5 - (5-メトキシ-3-ピリジル) - 3-ピラゾリル
966	Me	Me	5 - (2-キノリル) - 3-ピラゾリル
967	Me	Me	5 - (3-キノリル) - 3-ピラゾリル
968	Me	Me	2-エチル-4-チアゾリル
969	Me	Me	4-フェニル-2-チアゾリル
970	Me	Me	5-フェニル-2-チアゾリル
971	Me	Me	5 - (3-クロロフェニル) - 2-チアゾリル
972	Me	Me	5 - (4-クロロフェニル) - 2-チアゾリル
973	Me	Me	5 - (4-メトキシフェニル) - 2-チアゾリル
974	Me	Me	5 - (2-ピリジル) - 2-チアゾリル
975	Me	Me	4-フェニル-2-オキサゾリル
976	Me	Me	5-フェニル-2-オキサゾリル
977	Me	Me	4 - (3-メトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
978	Me	Me	4 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
979	Me	Me	4 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル

## (表2の続き)

980	Me	Me	3-フェニル-5-イソオキサゾリル
981	Me	Me	3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
982	Me	Me	3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
983	Me	Me	3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
984	Me	Me	3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル
985	Me	Me	5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
986	Me	Me	5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
987	Me	Me	5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
988	Me	Me	5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
989	Me	Me	5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
990	Me	Me	5-フェニル-2-ピリジル
991	Me	Me	5-フェニル-3-ピリジル
992	Me	Me	6-フェニル-3-ピリジル
993	Me	Me	2-フェニル-4-ピリジル
994	Me	Me	5-(2-ピリジル)-2-ピリジル
995	Me	Me	5-ベンゾイル-2-ピリジル
996	Me	Me	6-ベンゾイル-3-ピリジル
997	Me	Me	5-クロロ-2-ピラジニル
998	Me	Me	5-(1-メチルピニル)-2-ピラジニル
999	Me	Me	5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル
1000	Me	Me	5-アセチル-2-ピラジニル
1001	Me	Me	5-プロピオニル-2-ピラジニル
1002	Me	Me	5-フェニル-2-ピラジニル
1003	Me	Me	5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル
1004	Me	Me	5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル
1005	Me	Me	5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
1006	Me	Me	5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
1007	Me	Me	5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル
1008	Me	Me	5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル
1009	Me	Me	5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル
1010	Me	Me	5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル
1011	Me	Me	5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル
1012	Me	Me	5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル
1013	Me	Me	5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
1014	Me	Me	5-ベンゾイル-2-ピラジニル
1015	Me	Me	5-(2-ピリジルカルボニル)-2-ピラジニル
1016	Me	Me	5-アセチル-2-ピリミジニル
1017	Me	Me	5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル
1018	Me	Me	4-フェニル-2-ピリミジニル
1019	Me	Me	5-フェニル-2-ピリミジニル

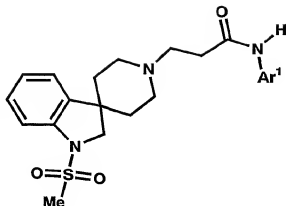
## (表 2 の続き)

1020	Me	Me	2-フェニル-4-ピリミジニル
1021	Me	Me	6-フェニル-4-ピリミジニル
1022	Me	Me	2-フェニル-5-ピリミジニル
1023	Me	Me	5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
1024	Me	Me	5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
1025	Me	Me	5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
1026	Me	Me	5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
1027	Me	Me	5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
1028	Me	Me	5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
1029	Me	Me	5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
1030	Me	Me	5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
1031	Me	Me	5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1032	Me	Me	5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1033	Me	Me	5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1034	Me	Me	5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1035	Me	Me	5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1036	Me	Me	5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1037	Me	Me	5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ピリミジニル
1038	Me	Me	5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
1039	Me	Me	5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピリミジニル
1040	Me	Me	5-(2-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1041	Me	Me	5-(3-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1042	Me	Me	5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1043	Me	Me	5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1044	Me	Me	5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1045	Me	Me	5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ピリミジニル
1046	Me	Me	5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ピリミジニル
1047	Me	Me	6-フェニル-3-ピリダジニル
1048	Me	Me	6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
1049	Me	Me	5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
1050	Me	Me	4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
1051	Me	Me	2-ベンゾチアゾリル
1052	Me	Me	5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
1053	Me	Me	4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
1054	Me	Me	6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
1055	Me	Me	4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
1056	Me	Me	2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
1057	Me	Me	4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
1058	Me	Me	5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
1059	Me	Me	6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル

## (表 2 の続き)

1060	Me	Me	3-キノリル
1061	Me	Me	6-キノリル
1062	Me	Me	6-メチル-2-キノリル
1063	Me	Me	7-メチル-2-キノリル
1064	Me	Me	8-メチル-2-キノリル
1065	Me	Me	2-メチル-6-キノリル
1066	Me	Me	6-クロロ-2-キノキサリニル
1067	Me	Me	7-クロロ-2-キノキサリニル
1068	Me	Me	6-メチル-2-キノキサリニル
1069	Me	Me	1, 5-ナフチリジン-2-イル
1070	Me	Me	7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
1071	Me	Me	7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
1072	Me	Me	7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
1073	Me	Me	7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
1074	Me	Me	7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

表 3



No. Ar 1

- 1075 3-フルオロフェニル
- 1076 4-フルオロフェニル
- 1077 3, 4-ジフルオロフェニル
- 1078 3-クロロフェニル
- 1079 4-クロロフェニル
- 1080 3, 4-ジクロロフェニル
- 1081 4-アセチルフェニル
- 1082 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
- 1083 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
- 1084 2-ピフェニル
- 1085 3-ピフェニル
- 1086 4-ピフェニル
- 1087 4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
- 1088 4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
- 1089 4-(2-チアゾリル) フェニル

(表 3 の続き)

- 1090 4- (2-エチル-4-チアゾリル) フェニル  
1091 3- (2-ビリジル) フェニル  
1092 3- (4-ビリジル) フェニル  
1093 4- (2-ビリジル) フェニル  
1094 4- (3-ビリジル) フェニル  
1095 4- (4-ビリジル) フェニル  
1096 4- (2-エチル-4-ビリジル) フェニル  
1097 4- (4-ビリミジル) フェニル  
1098 4-ベンゾイルフェニル  
1099 4- (2-ビリジルカルボニル) フェニル  
1100 1-ナフチル  
1101 9-オキソ-3-フルオレニル  
1102 1-メチル-2-イミダゾリル  
1103 1-フェニル-4-イミダゾリル  
1104 1- (2-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1105 1- (3-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1106 1- (4-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1107 1- (2, 3-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1108 1- (2, 4-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1109 1- (3, 5-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1110 1- (3-クロロフェニル) -4-イミダゾリル  
1111 1- (2-シアノフェニル) -4-イミダゾリル  
1112 1- (3-シアノフェニル) -4-イミダゾリル  
1113 1- (4-シアノフェニル) -4-イミダゾリル  
1114 1- (3-トリフルオロメチルフェニル) -4-イミダゾリル  
1115 1- [3- (2-ヒドロキシエチル) フェニル] -4-イミダゾリル  
1116 1- [3- (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] -4-イミダゾリル  
1117 1- (3-メトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
1118 1- (2-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
1119 1- (3-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
1120 1- (4-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
1121 1- (2-ビリジル) -4-イミダゾリル  
1122 1- (4-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル  
1123 1- (5-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル  
1124 1- (7-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル  
1125 1- (2-キノリル) -4-イミダゾリル  
1126 1- (3-キノリル) -4-イミダゾリル  
1127 1- (4-キノリル) -4-イミダゾリル  
1128 1- (5-キノリル) -4-イミダゾリル  
1129 1- (6-キノリル) -4-イミダゾリル



(表 3 の続き)

- 1130 1 - (8-キノリル) - 4-イミダゾリル  
1131 1-フェニル-3-ピラゾリル  
1132 5-フェニル-3-ピラゾリル  
1133 5- (2-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル  
1134 5- (3-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル  
1135 5- (4-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル  
1136 5- (2-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル  
1137 5- (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル  
1138 5- (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル  
1139 5- (3-メトキシフェニル) - 3-ピラゾリル  
1140 5- (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル  
1141 5- (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル  
1142 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル  
1143 5- (2-ビリジル) - 3-ピラゾリル  
1144 5- (5-メトキシ-3-ビリジル) - 3-ピラゾリル  
1145 5- (2-キノリル) - 3-ピラゾリル  
1146 5- (3-キノリル) - 3-ピラゾリル  
1147 2-エチル-4-チアゾリル  
1148 4-フェニル-2-チアゾリル  
1149 5-フェニル-2-チアゾリル  
1150 5- (3-クロロフェニル) - 2-チアゾリル  
1151 5- (4-クロロフェニル) - 2-チアゾリル  
1152 5- (4-メトキシフェニル) - 2-チアゾリル  
1153 5- (2-ビリジル) - 2-チアゾリル  
1154 4-フェニル-2-オキサゾリル  
1155 5-フェニル-2-オキサゾリル  
1156 4- (3-メトキシフェニル) - 2-オキサゾリル  
1157 4- (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル  
1158 4- (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル  
1159 3-フェニル-5-イソオキサゾリル  
1160 3- (2-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル  
1161 3- (3-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル  
1162 3- (4-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル  
1163 3- (2-ビリジル) - 5-イソオキサゾリル  
1164 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル  
1165 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1166 5- (3-クロロフェニル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1167 5- (2-ビリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1168 5- (2-エチル-4-ビリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1169 5-フェニル-2-ビリジル

## (表3の続き)

- 1170 5-フェニル-3-ビリジル
- 1171 6-フェニル-3-ビリジル
- 1172 2-フェニル-4-ビリジル
- 1173 5-(2-ビリジル)-2-ビリジル
- 1174 5-ベンゾイル-2-ビリジル
- 1175 6-ベンゾイル-3-ビリジル
- 1176 5-クロロ-2-ピラジニル
- 1177 5-(1-メチルピニル)-2-ピラジニル
- 1178 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル
- 1179 5-アセチル-2-ピラジニル
- 1180 5-プロピオニル-2-ピラジニル
- 1181 5-フェニル-2-ピラジニル
- 1182 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル
- 1183 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル
- 1184 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
- 1185 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
- 1186 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル
- 1187 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル
- 1188 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル
- 1189 5-(2-ビリジル)-2-ピラジニル
- 1190 5-(3-ビリジル)-2-ピラジニル
- 1191 5-(5-ビリミジニル)-2-ピラジニル
- 1192 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
- 1193 5-ベンゾイル-2-ピラジニル
- 1194 5-(2-ビリジルカルボニル)-2-ピラジニル
- 1195 5-アセチル-2-ビリミジニル
- 1196 5-アセチル-3-メチル-2-ビリミジニル
- 1197 4-フェニル-2-ビリミジニル
- 1198 5-フェニル-2-ビリミジニル
- 1199 2-フェニル-4-ビリミジニル
- 1200 6-フェニル-4-ビリミジニル
- 1201 2-フェニル-5-ビリミジニル
- 1202 5-(2-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
- 1203 5-(3-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
- 1204 5-(4-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
- 1205 5-(2-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
- 1206 5-(3-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
- 1207 5-(4-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
- 1208 5-(2-メチルフェニル)-2-ビリミジニル
- 1209 5-(3-メチルフェニル)-2-ビリミジニル

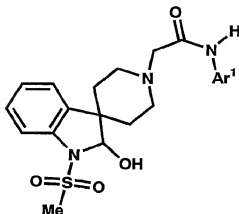
## (表3の続き)

- 1210 5- (2-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1211 5- (3-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1212 5- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1213 5- (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1214 5- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1215 5- (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1216 5- (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1217 5- (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1218 5- (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1219 5- (2-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1220 5- (3-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1221 5- (4-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1222 5- (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1223 5- (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1224 5- (2-フルオロ-5-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1225 5- (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1226 6-フェニル-3-ピリダジニル  
1227 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル  
1228 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル  
1229 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル  
1230 2-ベンゾチアゾリル  
1231 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル  
1232 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル  
1233 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル  
1234 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル  
1235 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル  
1236 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル  
1237 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル  
1238 6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル  
1239 3-キノリル  
1240 6-キノリル  
1241 6-メチル-2-キノリル  
1242 7-メチル-2-キノリル  
1243 8-メチル-2-キノリル  
1244 2-メチル-6-キノリル  
1245 6-クロロ-2-キノキサリニル  
1246 7-クロロ-2-キノキサリニル  
1247 6-メチル-2-キノキサリニル  
1248 1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1249 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル

(表 3 の続き)

- 1250 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
 1251 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
 1252 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
 1253 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

表 4



No. Ar 1

- 1254 3-フルオロフェニル  
 1255 4-フルオロフェニル  
 1256 3, 4-ジフルオロフェニル  
 1257 3-クロロフェニル  
 1258 4-クロロフェニル  
 1259 3, 4-ジクロロフェニル  
 1260 4-アセチルフェニル  
 1261 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル  
 1262 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル  
 1263 2-ビフェニル  
 1264 3-ビフェニル  
 1265 4-ビフェニル  
 1266 4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル  
 1267 4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル  
 1268 4-(2-チアゾリル) フェニル  
 1269 4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル

## (表 4 の続き)

- 1270 3- (2-ピリジル) フェニル  
1271 3- (4-ピリジル) フェニル  
1272 4- (2-ピリジル) フェニル  
1273 4- (3-ピリジル) フェニル  
1274 4- (4-ピリジル) フェニル  
1275 4- (2-エチル-4-ピリジル) フェニル  
1276 4- (4-ピリミジニル) フェニル  
1277 4-ベンゾイルフェニル  
1278 4- (2-ピリジルカルボニル) フェニル  
1279 1-ナフチル  
1280 9-オキソ-3-フルオレニル  
1281 1-メチル-2-イミダゾリル  
1282 1-フェニル-4-イミダゾリル  
1283 1- (2-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1284 1- (3-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1285 1- (4-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1286 1- (2, 3-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1287 1- (2, 4-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1288 1- (3, 5-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1289 1- (3-クロロフェニル) -4-イミダゾリル  
1290 1- (2-シアノフェニル) -4-イミダゾリル  
1291 1- (3-シアノフェニル) -4-イミダゾリル  
1292 1- (4-シアノフェニル) -4-イミダゾリル  
1293 1- (3-トリフルオロメチルフェニル) -4-イミダゾリル  
1294 1- [3- (2-ヒドロキシエチル) フェニル] -4-イミダゾリル  
1295 1- [3- (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] -4-イミダゾリル  
1296 1- (3-メトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
1297 1- (2-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
1298 1- (3-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
1299 1- (4-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
1300 1- (2-ピリジル) -4-イミダゾリル  
1301 1- (4-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル  
1302 1- (5-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル  
1303 1- (7-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル  
1304 1- (2-キノリル) -4-イミダゾリル  
1305 1- (3-キノリル) -4-イミダゾリル  
1306 1- (4-キノリル) -4-イミダゾリル  
1307 1- (5-キノリル) -4-イミダゾリル  
1308 1- (6-キノリル) -4-イミダゾリル  
1309 1- (8-キノリル) -4-イミダゾリル

(表4の続き)

- 1310 1-フェニル-3-ピラゾリル  
1311 5-フェニル-3-ピラゾリル  
1312 5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル  
1313 5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル  
1314 5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル  
1315 5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル  
1316 5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル  
1317 5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル  
1318 5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル  
1319 5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル  
1320 5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル  
1321 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル  
1322 5-(2-ピリジル)-3-ピラゾリル  
1323 5-(5-メトキシ-3-ピリジル)-3-ピラゾリル  
1324 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル  
1325 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル  
1326 2-エチル-4-チアゾリル  
1327 4-フェニル-2-チアゾリル  
1328 5-フェニル-2-チアゾリル  
1329 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル  
1330 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル  
1331 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル  
1332 5-(2-ピリジル)-2-チアゾリル  
1333 4-フェニル-2-オキサゾリル  
1334 5-フェニル-2-オキサゾリル  
1335 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル  
1336 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル  
1337 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル  
1338 3-フェニル-5-イソオキサゾリル  
1339 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル  
1340 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル  
1341 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル  
1342 3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル  
1343 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル  
1344 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1345 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1346 5-(2-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1347 5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1348 5-フェニル-2-ピリジル  
1349 5-フェニル-3-ピリジル

(表4の続き)

- 1350 6-フェニル-3-ピリジル  
1351 2-フェニル-4-ピリジル  
1352 5-(2-ピリジル)-2-ピリジル  
1353 5-ベンゾイル-2-ピリジル  
1354 6-ベンゾイル-3-ピリジル  
1355 5-クロロ-2-ピラジニル  
1356 5-(1-メチルピニル)-2-ピラジニル  
1357 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル  
1358 5-アセチル-2-ピラジニル  
1359 5-プロピオニル-2-ピラジニル  
1360 5-フェニル-2-ピラジニル  
1361 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル  
1362 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル  
1363 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル  
1364 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル  
1365 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル  
1366 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル  
1367 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル  
1368 5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル  
1369 5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル  
1370 5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル  
1371 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル  
1372 5-ベンゾイル-2-ピラジニル  
1373 5-(2-ピリジルカルボニル)-2-ピラジニル  
1374 5-アセチル-2-ピリミジニル  
1375 5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル  
1376 4-フェニル-2-ピリミジニル  
1377 5-フェニル-2-ピリミジニル  
1378 2-フェニル-4-ピリミジニル  
1379 6-フェニル-4-ピリミジニル  
1380 2-フェニル-5-ピリミジニル  
1381 5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル  
1382 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル  
1383 5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル  
1384 5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル  
1385 5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル  
1386 5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル  
1387 5-(2-メチルフェニル)-2-ピリミジニル  
1388 5-(3-メチルフェニル)-2-ピリミジニル  
1389 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ピリミジニル

## (表 4 の続き)

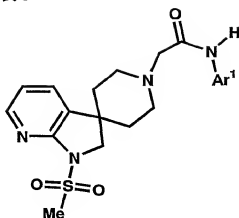
- 1390 5- (3-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1391 5- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1392 5- (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1393 5- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1394 5- (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1395 5- (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1396 5- (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1397 5- (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1398 5- (2-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1399 5- (3-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1400 5- (4-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1401 5- (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1402 5- (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1403 5- (2-フルオロ-5-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1404 5- (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1405 6-フェニル-3-ピリダジニル  
1406 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル  
1407 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル  
1408 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル  
1409 2-ベンゾチアゾリル  
1410 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル  
1411 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル  
1412 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル  
1413 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル  
1414 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル  
1415 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル  
1416 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル  
1417 6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル  
1418 3-キノリル  
1419 6-キノリル



(表4の続き)

- 1420 6-メチル-2-キノリル
- 1421 7-メチル-2-キノリル
- 1422 8-メチル-2-キノリル
- 1423 2-メチル-6-キノリル
- 1424 6-クロロ-2-キノキサリニル
- 1425 7-クロロ-2-キノキサリニル
- 1426 6-メチル-2-キノキサリニル
- 1427 1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 1428 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 1429 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 1430 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 1431 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
- 1432 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

表 5



No. Ar 1

- 1433 3-フルオロフェニル
- 1434 4-フルオロフェニル
- 1435 3, 4-ジフルオロフェニル
- 1436 3-クロロフェニル
- 1437 4-クロロフェニル
- 1438 3, 4-ジクロロフェニル
- 1439 4-アセチルフェニル
- 1440 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
- 1441 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
- 1442 2-ピフェニル
- 1443 3-ピフェニル
- 1444 4-ピフェニル
- 1445 4-(1-メチル-2-イミダゾリル)フェニル
- 1446 4-(1-エチル-2-イミダゾリル)フェニル
- 1447 4-(2-チアゾリル)フェニル
- 1448 4-(2-エチル-4-チアゾリル)フェニル
- 1449 3-(2-ピリジル)フェニル
- 1450 3-(4-ピリジル)フェニル
- 1451 4-(2-ピリジル)フェニル
- 1452 4-(3-ピリジル)フェニル
- 1453 4-(4-ピリジル)フェニル
- 1454 4-(2-エチル-4-ピリジル)フェニル
- 1455 4-(4-ピリミジニル)フェニル
- 1456 4-ベンゾイルフェニル
- 1457 4-(2-ピリジールカルボニル)フェニル
- 1458 1-ナフチル
- 1459 9-オキソ-3-フルオレニル

(表5の続き)

- 1460 1-メチル-2-イミダゾリル
- 1461 1-フェニル-4-イミダゾリル
- 1462 1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
- 1463 1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
- 1464 1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
- 1465 1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
- 1466 1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
- 1467 1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
- 1468 1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル
- 1469 1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
- 1470 1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
- 1471 1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
- 1472 1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル
- 1473 1-[3-(2-ヒドロキシエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
- 1474 1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル]-4-イミダゾリル
- 1475 1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル
- 1476 1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
- 1477 1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
- 1478 1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
- 1479 1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル
- 1480 1-(4-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
- 1481 1-(5-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
- 1482 1-(7-ベンゾ[b]フラニル)-4-イミダゾリル
- 1483 1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル
- 1484 1-(3-キノリル)-4-イミダゾリル
- 1485 1-(4-キノリル)-4-イミダゾリル
- 1486 1-(5-キノリル)-4-イミダゾリル
- 1487 1-(6-キノリル)-4-イミダゾリル
- 1488 1-(8-キノリル)-4-イミダゾリル
- 1489 1-フェニル-3-ピラゾリル
- 1490 5-フェニル-3-ピラゾリル
- 1491 5-(2-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
- 1492 5-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
- 1493 5-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリル
- 1494 5-(2-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
- 1495 5-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
- 1496 5-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル
- 1497 5-(3-メトキシフェニル)-3-ピラゾリル
- 1498 5-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル
- 1499 5-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-3-ピラゾリル

## (表 5 の続き)

- 1500 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル  
1501 5-(2-ビリジル)-3-ピラゾリル  
1502 5-(5-メトキシ-3-ビリジル)-3-ピラゾリル  
1503 5-(2-キノリル)-3-ピラゾリル  
1504 5-(3-キノリル)-3-ピラゾリル  
1505 2-エチル-4-チアゾリル  
1506 4-フェニル-2-チアゾリル  
1507 5-フェニル-2-チアゾリル  
1508 5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル  
1509 5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル  
1510 5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル  
1511 5-(2-ビリジル)-2-チアゾリル  
1512 4-フェニル-2-オキサゾリル  
1513 5-フェニル-2-オキサゾリル  
1514 4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル  
1515 4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル  
1516 4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル  
1517 3-フェニル-5-イソオキサゾリル  
1518 3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル  
1519 3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル  
1520 3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル  
1521 3-(2-ビリジル)-5-イソオキサゾリル  
1522 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル  
1523 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1524 5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1525 5-(2-ビリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1526 5-(2-エチル-4-ビリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1527 5-フェニル-2-ビリジル  
1528 5-フェニル-3-ビリジル  
1529 6-フェニル-3-ビリジル  
1530 2-フェニル-4-ビリジル  
1531 5-(2-ビリジル)-2-ビリジル  
1532 6-ベンゾイル-2-ビリジル  
1533 6-ベンゾイル-3-ビリジル  
1534 5-クロロ-2-ピラジニル  
1535 5-(1-メチルピニル)-2-ピラジニル  
1536 5-(2-メチル-1-プロベニル)-2-ピラジニル  
1537 5-アセチル-2-ピラジニル  
1538 5-プロピオニル-2-ピラジニル  
1539 5-フェニル-2-ピラジニル

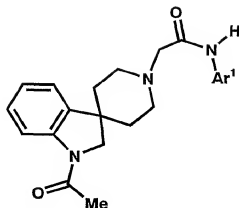
## (表 5 の続き)

- 1540 5- (3-フルオロフェニル) - 2-ピラジニル  
1541 5- (2-クロロフェニル) - 2-ピラジニル  
1542 5- (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピラジニル  
1543 5- (4-ヒドロキシフェニル) - 2-ピラジニル  
1544 5- (2-メトキシフェニル) - 2-ピラジニル  
1545 5- (1, 2, 4-チアアジアゾール-5-イル) - 2-ピラジニル  
1546 5- (1, 3, 4-チアアジアゾール-2-イル) - 2-ピラジニル  
1547 5- (2-ビリジル) - 2-ピラジニル  
1548 5- (3-ビリジル) - 2-ピラジニル  
1549 5- (5-ビリミジニル) - 2-ピラジニル  
1550 5- (3-キノリル) - 2-ピラジニル  
1551 5-ベンゾイル-2-ピラジニル  
1552 5- (2-ビリジルカルボニル) - 2-ピラジニル  
1553 5-アセチル-2-ビリミジニル  
1554 5-アセチル-3-メチル-2-ビリミジニル  
1555 4-フェニル-2-ビリミジニル  
1556 5-フェニル-2-ビリミジニル  
1557 2-フェニル-4-ビリミジニル  
1558 6-フェニル-4-ビリミジニル  
1559 2-フェニル-5-ビリミジニル  
1560 5- (2-フルオロフェニル) - 2-ビリミジニル  
1561 5- (3-フルオロフェニル) - 2-ビリミジニル  
1562 5- (4-フルオロフェニル) - 2-ビリミジニル  
1563 5- (2-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル  
1564 5- (3-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル  
1565 5- (4-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル  
1566 5- (2-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1567 5- (3-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1568 5- (2-フルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1569 5- (3-フルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1570 5- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1571 5- (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1572 5- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1573 5- (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1574 5- (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1575 5- (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1576 5- (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1577 5- (2-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1578 5- (3-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1579 5- (4-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル

(表 5 の続き)

- 1580 5 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1581 5 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1582 5 - (2-フルオロ-5-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル  
1583 5 - (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル  
1584 6-フェニル-3-ピリダジニル  
1585 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル  
1586 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル  
1587 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル  
1588 2-ベンゾチアゾリル  
1589 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル  
1590 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル  
1591 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル  
1592 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル  
1593 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル  
1594 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル  
1595 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル  
1596 6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル  
1597 3-キノリル  
1598 6-キノリル  
1599 6-メチル-2-キノリル  
1600 7-メチル-2-キノリル  
1601 8-メチル-2-キノリル  
1602 2-メチル-6-キノリル  
1603 6-クロロ-2-キノキサリニル  
1604 7-クロロ-2-キノキサリニル  
1605 6-メチル-2-キノキサリニル  
1606 1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1607 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1608 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1609 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1610 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1611 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

表 6



No. Ar 1

- 1612 3-フルオロフェニル
- 1613 4-フルオロフェニル
- 1614 3, 4-ジフルオロフェニル
- 1615 3-クロロフェニル
- 1616 4-クロロフェニル
- 1617 3, 4-ジクロロフェニル
- 1618 4-アセチルフェニル
- 1619 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
- 1620 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
- 1621 2-ピフェニル
- 1622 3-ピフェニル
- 1623 4-ピフェニル
- 1624 4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
- 1625 4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
- 1626 4-(2-チアゾリル) フェニル
- 1627 4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
- 1628 3-(2-ピリジル) フェニル
- 1629 3-(4-ピリジル) フェニル

(表 6 の続き)

- 1630 4- (2-ビリジル) フェニル
- 1631 4- (3-ビリジル) フェニル
- 1632 4- (4-ビリジル) フェニル
- 1633 4- (2-エチル-4-ビリジル) フェニル
- 1634 4- (4-ビリミジニル) フェニル
- 1635 4-ベンゾイルフェニル
- 1636 4- (2-ビリジルカルボニル) フェニル
- 1637 1-ナフチル
- 1638 9-オキソ-3-フルオレニル
- 1639 1-メチル-2-イミダゾリル
- 1640 1-フェニル-4-イミダゾリル
- 1641 1- (2-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
- 1642 1- (3-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
- 1643 1- (4-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
- 1644 1- (2, 3-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル
- 1645 1- (2, 4-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル
- 1646 1- (3, 5-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル
- 1647 1- (3-クロロフェニル) -4-イミダゾリル
- 1648 1- (2-シアノフェニル) -4-イミダゾリル
- 1649 1- (3-シアノフェニル) -4-イミダゾリル
- 1650 1- (4-シアノフェニル) -4-イミダゾリル
- 1651 1- (3-トリフルオロメチルフェニル) -4-イミダゾリル
- 1652 1- [3- (2-ヒドロキシエチル) フェニル] -4-イミダゾリル
- 1653 1- [3- (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] -4-イミダゾリル
- 1654 1- (3-メトキシフェニル) -4-イミダゾリル
- 1655 1- (2-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル
- 1656 1- (3-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル
- 1657 1- (4-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル
- 1658 1- (2-ビリジル) -4-イミダゾリル
- 1659 1- (4-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル
- 1660 1- (5-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル
- 1661 1- (7-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル
- 1662 1- (2-キノリル) -4-イミダゾリル
- 1663 1- (3-キノリル) -4-イミダゾリル
- 1664 1- (4-キノリル) -4-イミダゾリル
- 1665 1- (5-キノリル) -4-イミダゾリル
- 1666 1- (6-キノリル) -4-イミダゾリル
- 1667 1- (8-キノリル) -4-イミダゾリル
- 1668 1-フェニル-3-ピラゾリル
- 1669 5-フェニル-3-ピラゾリル



## (表 6 の続き)

- 1670 5- (2-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル  
1671 5- (3-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル  
1672 5- (4-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル  
1673 5- (2-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル  
1674 5- (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル  
1675 5- (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル  
1676 5- (3-メトキシフェニル) - 3-ピラゾリル  
1677 5- (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル  
1678 5- (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル  
1679 2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル  
1680 5- (2-ビリジル) - 3-ピラゾリル  
1681 5- (5-メトキシ-3-ビリジル) - 3-ピラゾリル  
1682 5- (2-キノリル) - 3-ピラゾリル  
1683 5- (3-キノリル) - 3-ピラゾリル  
1684 2-エチル-4-チアゾリル  
1685 4-フェニル-2-チアゾリル  
1686 5-フェニル-2-チアゾリル  
1687 5- (3-クロロフェニル) - 2-チアゾリル  
1688 5- (4-クロロフェニル) - 2-チアゾリル  
1689 5- (4-メトキシフェニル) - 2-チアゾリル  
1690 5- (2-ビリジル) - 2-チアゾリル  
1691 4-フェニル-2-オキサゾリル  
1692 5-フェニル-2-オキサゾリル  
1693 4- (3-メトキシフェニル) - 2-オキサゾリル  
1694 4- (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル  
1695 4- (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル  
1696 3-フェニル-5-イソオキサゾリル  
1697 3- (2-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル  
1698 3- (3-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル  
1699 3- (4-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル  
1700 3- (2-ビリジル) - 5-イソオキサゾリル  
1701 5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル  
1702 5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1703 5- (3-クロロフェニル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1704 5- (2-ビリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1705 5- (2-エチル-4-ビリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル  
1706 5-フェニル-2-ビリジル  
1707 5-フェニル-3-ビリジル  
1708 6-フェニル-3-ビリジル  
1709 2-フェニル-4-ビリジル

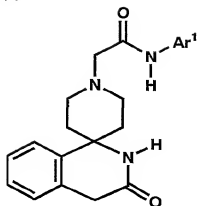
## (表6の続き)

- 1710 5- (2-ビリジル) - 2-ビリジル  
1711 5-ベンゾイル-2-ビリジル  
1712 6-ベンゾイル-3-ビリジル  
1713 5-クロロ-2-ピラジニル  
1714 5- (1-メチルピニル) - 2-ピラジニル  
1715 5- (2-メチル-1-プロベニル) - 2-ピラジニル  
1716 5-アセチル-2-ピラジニル  
1717 5-プロピオニル-2-ピラジニル  
1718 5-フェニル-2-ピラジニル  
1719 5- (3-フルオロフェニル) - 2-ピラジニル  
1720 5- (2-クロロフェニル) - 2-ピラジニル  
1721 5- (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピラジニル  
1722 5- (4-ヒドロキシフェニル) - 2-ピラジニル  
1723 5- (2-メトキシフェニル) - 2-ピラジニル  
1724 5- (1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル) - 2-ピラジニル  
1725 5- (1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル) - 2-ピラジニル  
1726 5- (2-ビリジル) - 2-ピラジニル  
1727 5- (3-ビリジル) - 2-ピラジニル  
1728 5- (5-ビリミジニル) - 2-ピラジニル  
1729 5- (3-キノリル) - 2-ピラジニル  
1730 5-ベンゾイル-2-ピラジニル  
1731 5- (2-ビリジルカルボニル) - 2-ピラジニル  
1732 5-アセチル-2-ビリミジニル  
1733 5-アセチル-3-メチル-2-ビリミジニル  
1734 4-フェニル-2-ビリミジニル  
1735 5-フェニル-2-ビリミジニル  
1736 2-フェニル-4-ビリミジニル  
1737 6-フェニル-4-ビリミジニル  
1738 2-フェニル-5-ビリミジニル  
1739 5- (2-フルオロフェニル) - 2-ビリミジニル  
1740 5- (3-フルオロフェニル) - 2-ビリミジニル  
1741 5- (4-フルオロフェニル) - 2-ビリミジニル  
1742 5- (2-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル  
1743 5- (3-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル  
1744 5- (4-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル  
1745 5- (2-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1746 5- (3-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1747 5- (2-フルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1748 5- (3-フルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1749 5- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル

## (表 6 の続き)

- 1750 5- (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1751 5- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1752 5- (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1753 5- (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1754 5- (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1755 5- (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1756 5- (2-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1757 5- (3-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1758 5- (4-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1759 5- (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1760 5- (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1761 5- (2-フルオロ-5-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1762 5- (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1763 6-フェニル-3-ビリダジニル  
1764 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル  
1765 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル  
1766 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル  
1767 2-ベンゾチアゾリル  
1768 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル  
1769 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル  
1770 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル  
1771 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル  
1772 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル  
1773 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル  
1774 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル  
1775 6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル  
1776 3-キノリル  
1777 6-キノリル  
1778 6-メチル-2-キノリル  
1779 7-メチル-2-キノリル  
1780 8-メチル-2-キノリル  
1781 2-メチル-6-キノリル  
1782 6-クロロ-2-キノキサリニル  
1783 7-クロロ-2-キノキサリニル  
1784 6-メチル-2-キノキサリニル  
1785 1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1786 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1787 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1788 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1789 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1790 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

表 7



No. Ar 1

- 1791 3-フルオロフェニル
- 1792 4-フルオロフェニル
- 1793 3, 4-ジフルオロフェニル
- 1794 3-クロロフェニル
- 1795 4-クロロフェニル
- 1796 3, 4-ジクロロフェニル
- 1797 4-アセチルフェニル
- 1798 5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
- 1799 4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
- 1800 2-ピフェニル
- 1801 3-ピフェニル
- 1802 4-ピフェニル
- 1803 4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
- 1804 4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
- 1805 4-(2-チアゾリル) フェニル
- 1806 4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
- 1807 3-(2-ピリジル) フェニル
- 1808 3-(4-ピリジル) フェニル
- 1809 4-(2-ピリジル) フェニル

(表 7 の続き)

- 1810 4- (3-ビリジル) フェニル  
1811 4- (4-ビリジル) フェニル  
1812 4- (2-エチル-4-ビリジル) フェニル  
1813 4- (4-ビリミジニル) フェニル  
1814 4-ベンゾイルフェニル  
1815 4- (2-ビリジルカルボニル) フェニル  
1816 1-ナフチル  
1817 9-オキソ-3-フルオレニル  
1818 1-メチル-2-イミダゾリル  
1819 1-フェニル-4-イミダゾリル  
1820 1- (2-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1821 1- (3-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1822 1- (4-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1823 1- (2, 3-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1824 1- (2, 4-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1825 1- (3, 5-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル  
1826 1- (3-クロロフェニル) -4-イミダゾリル  
1827 1- (2-シアノフェニル) -4-イミダゾリル  
1828 1- (3-シアノフェニル) -4-イミダゾリル  
1829 1- (4-シアノフェニル) -4-イミダゾリル  
1830 1- (3-トリフルオロメチルフェニル) -4-イミダゾリル  
1831 1- [3- (2-ヒドロキシエチル) フェニル] -4-イミダゾリル  
1832 1- [3- (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] -4-イミダゾリル  
1833 1- (3-メトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
1834 1- (2-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
1835 1- (3-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
1836 1- (4-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル  
1837 1- (2-ビリジル) -4-イミダゾリル  
1838 1- (4-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル  
1839 1- (5-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル  
1840 1- (7-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル  
1841 1- (2-キノリル) -4-イミダゾリル  
1842 1- (3-キノリル) -4-イミダゾリル  
1843 1- (4-キノリル) -4-イミダゾリル  
1844 1- (5-キノリル) -4-イミダゾリル  
1845 1- (6-キノリル) -4-イミダゾリル  
1846 1- (8-キノリル) -4-イミダゾリル  
1847 1-フェニル-3-ピラゾリル  
1848 5-フェニル-3-ピラゾリル  
1849 5- (2-フルオロフェニル) -3-ピラゾリル

## (表7の続き)

1850	5-	(3-フルオロフェニル)	-	3-ビラゾリル
1851	5-	(4-フルオロフェニル)	-	3-ビラゾリル
1852	5-	(2-クロロフェニル)	-	3-ビラゾリル
1853	5-	(3-クロロフェニル)	-	3-ビラゾリル
1854	5-	(4-クロロフェニル)	-	3-ビラゾリル
1855	5-	(3-メトキシフェニル)	-	3-ビラゾリル
1856	5-	(2-ジフルオロメトキシフェニル)	-	3-ビラゾリル
1857	5-	(3-ジフルオロメトキシフェニル)	-	3-ビラゾリル
1858	2-	メチル-5-フェニル	-	3-ビラゾリル
1859	5-	(2-ビリジル)	-	3-ビラゾリル
1860	5-	(5-メトキシ-3-ビリジル)	-	3-ビラゾリル
1861	5-	(2-キノリル)	-	3-ビラゾリル
1862	5-	(3-キノリル)	-	3-ビラゾリル
1863	2-	エチル-4-チアゾリル		
1864	4-	フェニル-2-チアゾリル		
1865	5-	フェニル-2-チアゾリル		
1866	5-	(3-クロロフェニル)	-	2-チアゾリル
1867	5-	(4-クロロフェニル)	-	2-チアゾリル
1868	5-	(4-メトキシフェニル)	-	2-チアゾリル
1869	5-	(2-ビリジル)	-	2-チアゾリル
1870	4-	フェニル-2-オキサゾリル		
1871	5-	フェニル-2-オキサゾリル		
1872	4-	(3-メトキシフェニル)	-	2-オキサゾリル
1873	4-	(2-フルオロメトキシフェニル)	-	2-オキサゾリル
1874	4-	(3-フルオロメトキシフェニル)	-	2-オキサゾリル
1875	3-	フェニル-5-イソオキサゾリル		
1876	3-	(2-クロロフェニル)	-	5-イソオキサゾリル
1877	3-	(3-クロロフェニル)	-	5-イソオキサゾリル
1878	3-	(4-クロロフェニル)	-	5-イソオキサゾリル
1879	3-	(2-ビリジル)	-	5-イソオキサゾリル
1880	5-	フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール	-	3-イル
1881	5-	フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール	-	2-イル
1882	5-	(3-クロロフェニル)	-	1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
1883	5-	(2-ビリジル)	-	1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
1884	5-	(2-エチル-4-ビリジル)	-	1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
1885	5-	フェニル-2-ビリジル		
1886	5-	フェニル-3-ビリジル		
1887	6-	フェニル-3-ビリジル		
1888	2-	フェニル-4-ビリジル		
1889	5-	(2-ビリジル)	-	2-ビリジル

## (表 7 の続き)

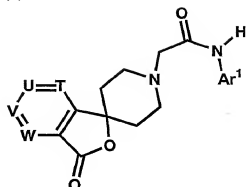
- 1890 5-ベンゾイル-2-ビリジル  
1891 6-ベンゾイル-3-ビリジル  
1892 5-クロロ-2-ピラジニル  
1893 5-(1-メチルピニル)-2-ピラジニル  
1894 5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル  
1895 5-アセチル-2-ピラジニル  
1896 5-プロピオニル-2-ピラジニル  
1897 5-フェニル-2-ピラジニル  
1898 5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル  
1899 5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル  
1900 5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル  
1901 5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル  
1902 5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル  
1903 5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル  
1904 5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル  
1905 5-(2-ビリジル)-2-ピラジニル  
1906 5-(3-ビリジル)-2-ピラジニル  
1907 5-(5-ビリミジニル)-2-ピラジニル  
1908 5-(3-キノリル)-2-ピラジニル  
1909 5-ベンゾイル-2-ピラジニル  
1910 5-(2-ビリジルカルボニル)-2-ピラジニル  
1911 5-アセチル-2-ビリミジニル  
1912 5-アセチル-3-メチル-2-ビリミジニル  
1913 4-フェニル-2-ビリミジニル  
1914 5-フェニル-2-ビリミジニル  
1915 2-フェニル-4-ビリミジニル  
1916 6-フェニル-4-ビリミジニル  
1917 2-フェニル-5-ビリミジニル  
1918 5-(2-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル  
1919 5-(3-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル  
1920 5-(4-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル  
1921 5-(2-クロロフェニル)-2-ビリミジニル  
1922 5-(3-クロロフェニル)-2-ビリミジニル  
1923 5-(4-クロロフェニル)-2-ビリミジニル  
1924 5-(2-メチルフェニル)-2-ビリミジニル  
1925 5-(3-メチルフェニル)-2-ビリミジニル  
1926 5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル  
1927 5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル  
1928 5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル  
1929 5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル

## (表 7 の続き)

- 1930 5- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1931 5- (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1932 5- (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1933 5- (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1934 5- (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1935 5- (2-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1936 5- (3-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1937 5- (4-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1938 5- (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1939 5- (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1940 5- (2-フルオロ-5-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル  
1941 5- (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル  
1942 6-フェニル-3-ビリダジニル  
1943 6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル  
1944 5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル  
1945 4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル  
1946 2-ベンゾチアゾリル  
1947 5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル  
1948 4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル  
1949 6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル  
1950 4-メチル-2-ベンゾチアゾリル  
1951 2-メチル-5-ベンゾチアゾリル  
1952 4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル  
1953 5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル  
1954 6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル  
1955 3-キノリル  
1956 6-キノリル  
1957 6-メチル-2-キノリル  
1958 7-メチル-2-キノリル  
1959 8-メチル-2-キノリル  
1960 2-メチル-6-キノリル  
1961 6-クロロ-2-キノキサリニル  
1962 7-クロロ-2-キノキサリニル  
1963 6-メチル-2-キノキサリニル  
1964 1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1965 7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1966 7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1967 7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1968 7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル  
1969 7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル



表 8



No.	T	U	V	W	Ar 1
1970	CH	CH	CH	CH	3-フルオロフェニル
1971	CH	CH	CH	CH	4-フルオロフェニル
1972	CH	CH	CH	CH	3, 4-ジフルオロフェニル
1973	CH	CH	CH	CH	3-クロロフェニル
1974	CH	CH	CH	CH	4-クロロフェニル
1975	CH	CH	CH	CH	3, 4-ジクロロフェニル
1976	CH	CH	CH	CH	4-アセチルフェニル
1977	CH	CH	CH	CH	5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
1978	CH	CH	CH	CH	4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
1979	CH	CH	CH	CH	2-ピフェニル
1980	CH	CH	CH	CH	3-ピフェニル
1981	CH	CH	CH	CH	4-ピフェニル
1982	CH	CH	CH	CH	4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
1983	CH	CH	CH	CH	4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
1984	CH	CH	CH	CH	4-(2-チアゾリル) フェニル
1985	CH	CH	CH	CH	4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
1986	CH	CH	CH	CH	3-(2-ピリジル) フェニル
1987	CH	CH	CH	CH	3-(4-ピリジル) フェニル
1988	CH	CH	CH	CH	4-(2-ピリジル) フェニル
1989	CH	CH	CH	CH	4-(3-ピリジル) フェニル
1990	CH	CH	CH	CH	4-(4-ピリジル) フェニル
1991	CH	CH	CH	CH	4-(2-エチル-4-ピリジル) フェニル
1992	CH	CH	CH	CH	4-(4-ピリミジニル) フェニル
1993	CH	CH	CH	CH	4-ベンゾイルフェニル
1994	CH	CH	CH	CH	4-(2-ピリジルカルボニル) フェニル
1995	CH	CH	CH	CH	1-ナフチル
1996	CH	CH	CH	CH	9-オキソ-3-フルオレニル
1997	CH	CH	CH	CH	1-メチル-2-イミダゾリル
1998	CH	CH	CH	CH	1-フェニル-4-イミダゾリル
1999	CH	CH	CH	CH	1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル

(表 8 の続き)

2000	CH	CH	CH	CH	1 - (3 - フルオロフェニル) - 4 - イミダゾリル
2001	CH	CH	CH	CH	1 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - イミダゾリル
2002	CH	CH	CH	CH	1 - (2, 3 - ジフルオロフェニル) - 4 - イミダゾリル
2003	CH	CH	CH	CH	1 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 4 - イミダゾリル
2004	CH	CH	CH	CH	1 - (3, 5 - ジフルオロフェニル) - 4 - イミダゾリル
2005	CH	CH	CH	CH	1 - (3 - クロロフェニル) - 4 - イミダゾリル
2006	CH	CH	CH	CH	1 - (2 - シアノフェニル) - 4 - イミダゾリル
2007	CH	CH	CH	CH	1 - (3 - シアノフェニル) - 4 - イミダゾリル
2008	CH	CH	CH	CH	1 - (4 - シアノフェニル) - 4 - イミダゾリル
2009	CH	CH	CH	CH	1 - (3 - トリフルオロメチルフェニル) - 4 - イミダゾリル
2010	CH	CH	CH	CH	1 - [3 - (2 - ヒドロキシエチル) フェニル] - 4 - イミダゾリル
2011	CH	CH	CH	CH	1 - [3 - (1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) フェニル] - 4 - イミダゾリル
2012	CH	CH	CH	CH	1 - (3 - メトキシフェニル) - 4 - イミダゾリル
2013	CH	CH	CH	CH	1 - (2 - ジフルオロメトキシフェニル) - 4 - イミダゾリル
2014	CH	CH	CH	CH	1 - (3 - ジフルオロメトキシフェニル) - 4 - イミダゾリル
2015	CH	CH	CH	CH	1 - (4 - ジフルオロメトキシフェニル) - 4 - イミダゾリル
2016	CH	CH	CH	CH	1 - (2 - ビリジル) - 4 - イミダゾリル
2017	CH	CH	CH	CH	1 - (4 - ベンゾ [b] フラニル) - 4 - イミダゾリル
2018	CH	CH	CH	CH	1 - (5 - ベンゾ [b] フラニル) - 4 - イミダゾリル
2019	CH	CH	CH	CH	1 - (7 - ベンゾ [b] フラニル) - 4 - イミダゾリル
2020	CH	CH	CH	CH	1 - (2 - キノリル) - 4 - イミダゾリル
2021	CH	CH	CH	CH	1 - (3 - キノリル) - 4 - イミダゾリル
2022	CH	CH	CH	CH	1 - (4 - キノリル) - 4 - イミダゾリル
2023	CH	CH	CH	CH	1 - (5 - キノリル) - 4 - イミダゾリル
2024	CH	CH	CH	CH	1 - (6 - キノリル) - 4 - イミダゾリル
2025	CH	CH	CH	CH	1 - (8 - キノリル) - 4 - イミダゾリル
2026	CH	CH	CH	CH	1 - フェニル - 3 - ビラゾリル
2027	CH	CH	CH	CH	5 - フェニル - 3 - ビラゾリル
2028	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - フルオロフェニル) - 3 - ビラゾリル
2029	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - フルオロフェニル) - 3 - ビラゾリル
2030	CH	CH	CH	CH	5 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - ビラゾリル
2031	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - クロロフェニル) - 3 - ビラゾリル
2032	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - クロロフェニル) - 3 - ビラゾリル
2033	CH	CH	CH	CH	5 - (4 - クロロフェニル) - 3 - ビラゾリル
2034	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - ビラゾリル
2035	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - ジフルオロメトキシフェニル) - 3 - ビラゾリル
2036	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - ジフルオロメトキシフェニル) - 3 - ビラゾリル
2037	CH	CH	CH	CH	2 - メチル - 5 - フェニル - 3 - ビラゾリル
2038	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - ビリジル) - 3 - ビラゾリル
2039	CH	CH	CH	CH	5 - (5 - メトキシ - 3 - ビリジル) - 3 - ビラゾリル

## (表 8 の続き)

2040	CH	CH	CH	CH	5 - (2-キノリル) - 3-ピラゾリル
2041	CH	CH	CH	CH	5 - (3-キノリル) - 3-ピラゾリル
2042	CH	CH	CH	CH	2-エチル-4-チアゾリル
2043	CH	CH	CH	CH	4-フェニル-2-チアゾリル
2044	CH	CH	CH	CH	5-フェニル-2-チアゾリル
2045	CH	CH	CH	CH	5 - (3-クロロフェニル) - 2-チアゾリル
2046	CH	CH	CH	CH	5 - (4-クロロフェニル) - 2-チアゾリル
2047	CH	CH	CH	CH	5 - (4-メトキシフェニル) - 2-チアゾリル
2048	CH	CH	CH	CH	5 - (2-ピリジル) - 2-チアゾリル
2049	CH	CH	CH	CH	4-フェニル-2-オキサゾリル
2050	CH	CH	CH	CH	5-フェニル-2-オキサゾリル
2051	CH	CH	CH	CH	4 - (3-メトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
2052	CH	CH	CH	CH	4 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
2053	CH	CH	CH	CH	4 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
2054	CH	CH	CH	CH	3-フェニル-5-イソオキサゾリル
2055	CH	CH	CH	CH	3 - (2-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
2056	CH	CH	CH	CH	3 - (3-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
2057	CH	CH	CH	CH	3 - (4-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
2058	CH	CH	CH	CH	3 - (2-ピリジル) - 5-イソオキサゾリル
2059	CH	CH	CH	CH	5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
2060	CH	CH	CH	CH	5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2061	CH	CH	CH	CH	5 - (3-クロロフェニル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2062	CH	CH	CH	CH	5 - (2-ピリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2063	CH	CH	CH	CH	5 - (2-エチル-4-ピリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2064	CH	CH	CH	CH	5-フェニル-2-ピリジル
2065	CH	CH	CH	CH	5-フェニル-3-ピリジル
2066	CH	CH	CH	CH	6-フェニル-3-ピリジル
2067	CH	CH	CH	CH	2-フェニル-4-ピリジル
2068	CH	CH	CH	CH	5 - (2-ピリジル) - 2-ピリジル
2069	CH	CH	CH	CH	5-ベンゾイル-2-ピリジル
2070	CH	CH	CH	CH	6-ベンゾイル-3-ピリジル
2071	CH	CH	CH	CH	5-クロロ-2-ピラジニル
2072	CH	CH	CH	CH	5 - (1-メチルピニル) - 2-ピラジニル
2073	CH	CH	CH	CH	5 - (2-メチル-1-プロペニル) - 2-ピラジニル
2074	CH	CH	CH	CH	5-アセチル-2-ピラジニル
2075	CH	CH	CH	CH	5-プロピオニル-2-ピラジニル
2076	CH	CH	CH	CH	5-フェニル-2-ピラジニル
2077	CH	CH	CH	CH	5 - (3-フルオロフェニル) - 2-ピラジニル
2078	CH	CH	CH	CH	5 - (2-クロロフェニル) - 2-ピラジニル
2079	CH	CH	CH	CH	5 - (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピラジニル

(表 8 の続き)

2080	CH	CH	CH	CH	5 - (4 - ヒドロキシフェニル) - 2 - ビラジニル
2081	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - メトキシフェニル) - 2 - ビラジニル
2082	CH	CH	CH	CH	5 - (1, 2, 4 - チアジアゾール - 5 - イル) - 2 - ビラジニル
2083	CH	CH	CH	CH	5 - (1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 2 - ビラジニル
2084	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - ビリジニル) - 2 - ビラジニル
2085	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - ビリジニル) - 2 - ビラジニル
2086	CH	CH	CH	CH	5 - (5 - ビリミジニル) - 2 - ビラジニル
2087	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - キノリル) - 2 - ビラジニル
2088	CH	CH	CH	CH	5 - ベンゾイル - 2 - ビラジニル
2089	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - ビリジニルカルボニル) - 2 - ビラジニル
2090	CH	CH	CH	CH	5 - アセチル - 2 - ビリミジニル
2091	CH	CH	CH	CH	5 - アセチル - 3 - メチル - 2 - ビリミジニル
2092	CH	CH	CH	CH	4 - フェニル - 2 - ビリミジニル
2093	CH	CH	CH	CH	5 - フェニル - 2 - ビリミジニル
2094	CH	CH	CH	CH	2 - フェニル - 4 - ビリミジニル
2095	CH	CH	CH	CH	6 - フェニル - 4 - ビリミジニル
2096	CH	CH	CH	CH	2 - フェニル - 5 - ビリミジニル
2097	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - ビリミジニル
2098	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - フルオロフェニル) - 2 - ビリミジニル
2099	CH	CH	CH	CH	5 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - ビリミジニル
2100	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - クロロフェニル) - 2 - ビリミジニル
2101	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - クロロフェニル) - 2 - ビリミジニル
2102	CH	CH	CH	CH	5 - (4 - クロロフェニル) - 2 - ビリミジニル
2103	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - メチルフェニル) - 2 - ビリミジニル
2104	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - メチルフェニル) - 2 - ビリミジニル
2105	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - フルオロメチルフェニル) - 2 - ビリミジニル
2106	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - フルオロメチルフェニル) - 2 - ビリミジニル
2107	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - ビリミジニル
2108	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - ビリミジニル
2109	CH	CH	CH	CH	5 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - ビリミジニル
2110	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - ヒドロキシメチルフェニル) - 2 - ビリミジニル
2111	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - ヒドロキシメチルフェニル) - 2 - ビリミジニル
2112	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - ヒドロキシフェニル) - 2 - ビリミジニル
2113	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - ヒドロキシフェニル) - 2 - ビリミジニル
2114	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - メトキシフェニル) - 2 - ビリミジニル
2115	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - メトキシフェニル) - 2 - ビリミジニル
2116	CH	CH	CH	CH	5 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - ビリミジニル
2117	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - フルオロメトキシフェニル) - 2 - ビリミジニル
2118	CH	CH	CH	CH	5 - (3 - フルオロメトキシフェニル) - 2 - ビリミジニル
2119	CH	CH	CH	CH	5 - (2 - フルオロ - 5 - メチルフェニル) - 2 - ビリミジニル

## (表 8 の続き)

2120	CH	CH	CH	CH	5- (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) -2-ビリミジニル
2121	CH	CH	CH	CH	6-フェニル-3-ビリダジニル
2122	CH	CH	CH	CH	6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
2123	CH	CH	CH	CH	5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
2124	CH	CH	CH	CH	4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
2125	CH	CH	CH	CH	2-ベンゾチアゾリル
2126	CH	CH	CH	CH	5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
2127	CH	CH	CH	CH	4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
2128	CH	CH	CH	CH	6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
2129	CH	CH	CH	CH	4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
2130	CH	CH	CH	CH	2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
2131	CH	CH	CH	CH	4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
2132	CH	CH	CH	CH	5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
2133	CH	CH	CH	CH	6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル
2134	CH	CH	CH	CH	3-キノリル
2135	CH	CH	CH	CH	6-キノリル
2136	CH	CH	CH	CH	6-メチル-2-キノリル
2137	CH	CH	CH	CH	7-メチル-2-キノリル
2138	CH	CH	CH	CH	8-メチル-2-キノリル
2139	CH	CH	CH	CH	2-メチル-6-キノリル
2140	CH	CH	CH	CH	6-クロロ-2-キノキサリニル
2141	CH	CH	CH	CH	7-クロロ-2-キノキサリニル
2142	CH	CH	CH	CH	6-メチル-2-キノキサリニル
2143	CH	CH	CH	CH	1, 5-ナフチリジン-2-イル
2144	CH	CH	CH	CH	7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2145	CH	CH	CH	CH	7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2146	CH	CH	CH	CH	7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2147	CH	CH	CH	CH	7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2148	CH	CH	CH	CH	7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2149	N	CH	CH	CH	3-フルオロフェニル
2150	N	CH	CH	CH	4-フルオロフェニル
2151	N	CH	CH	CH	3, 4-ジフルオロフェニル
2152	N	CH	CH	CH	3-クロロフェニル
2153	N	CH	CH	CH	4-クロロフェニル
2154	N	CH	CH	CH	3, 4-ジクロロフェニル
2155	N	CH	CH	CH	4-アセチルフェニル
2156	N	CH	CH	CH	5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
2157	N	CH	CH	CH	4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
2158	N	CH	CH	CH	2-ビフェニル
2159	N	CH	CH	CH	3-ビフェニル

## (表 8 の続き)

2160 N	CH	CH	CH	4-ビフェニル
2161 N	CH	CH	CH	4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
2162 N	CH	CH	CH	4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
2163 N	CH	CH	CH	4-(2-チアゾリル) フェニル
2164 N	CH	CH	CH	4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
2165 N	CH	CH	CH	3-(2-ピリジル) フェニル
2166 N	CH	CH	CH	3-(4-ピリジル) フェニル
2167 N	CH	CH	CH	4-(2-ピリジル) フェニル
2168 N	CH	CH	CH	4-(3-ピリジル) フェニル
2169 N	CH	CH	CH	4-(4-ピリジル) フェニル
2170 N	CH	CH	CH	4-(2-エチル-4-ピリジル) フェニル
2171 N	CH	CH	CH	4-(4-ピリミジニル) フェニル
2172 N	CH	CH	CH	4-ベンゾイルフェニル
2173 N	CH	CH	CH	4-(2-ピリジルカルボニル) フェニル
2174 N	CH	CH	CH	1-ナフチル
2175 N	CH	CH	CH	9-オキソ-3-フルオレニル
2176 N	CH	CH	CH	1-メチル-2-イミダゾリル
2177 N	CH	CH	CH	1-フェニル-4-イミダゾリル
2178 N	CH	CH	CH	1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
2179 N	CH	CH	CH	1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
2180 N	CH	CH	CH	1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
2181 N	CH	CH	CH	1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
2182 N	CH	CH	CH	1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
2183 N	CH	CH	CH	1-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
2184 N	CH	CH	CH	1-(3-クロロフェニル)-4-イミダゾリル
2185 N	CH	CH	CH	1-(2-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
2186 N	CH	CH	CH	1-(3-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
2187 N	CH	CH	CH	1-(4-シアノフェニル)-4-イミダゾリル
2188 N	CH	CH	CH	1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-イミダゾリル
2189 N	CH	CH	CH	1-[3-(2-ヒドロキシエチル) フェニル]-4-イミダゾリル
2190 N	CH	CH	CH	1-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル]-4-イミダゾリル
2191 N	CH	CH	CH	1-(3-メトキシフェニル)-4-イミダゾリル
2192 N	CH	CH	CH	1-(2-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
2193 N	CH	CH	CH	1-(3-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
2194 N	CH	CH	CH	1-(4-ジフルオロメトキシフェニル)-4-イミダゾリル
2195 N	CH	CH	CH	1-(2-ピリジル)-4-イミダゾリル
2196 N	CH	CH	CH	1-(4-ベンゾ [b] フラニル)-4-イミダゾリル
2197 N	CH	CH	CH	1-(5-ベンゾ [b] フラニル)-4-イミダゾリル
2198 N	CH	CH	CH	1-(7-ベンゾ [b] フラニル)-4-イミダゾリル
2199 N	CH	CH	CH	1-(2-キノリル)-4-イミダゾリル

(表 8 の続き)

2200 N	CH	CH	CH	1 - (3-キノリル) - 4-イミダゾリル
2201 N	CH	CH	CH	1 - (4-キノリル) - 4-イミダゾリル
2202 N	CH	CH	CH	1 - (5-キノリル) - 4-イミダゾリル
2203 N	CH	CH	CH	1 - (6-キノリル) - 4-イミダゾリル
2204 N	CH	CH	CH	1 - (8-キノリル) - 4-イミダゾリル
2205 N	CH	CH	CH	1-フェニル-3-ピラゾリル
2206 N	CH	CH	CH	5-フェニル-3-ピラゾリル
2207 N	CH	CH	CH	5 - (2-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
2208 N	CH	CH	CH	5 - (3-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
2209 N	CH	CH	CH	5 - (4-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
2210 N	CH	CH	CH	5 - (2-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
2211 N	CH	CH	CH	5 - (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
2212 N	CH	CH	CH	5 - (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
2213 N	CH	CH	CH	5 - (3-メトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
2214 N	CH	CH	CH	5 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
2215 N	CH	CH	CH	5 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
2216 N	CH	CH	CH	2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
2217 N	CH	CH	CH	5 - (2-ピリジル) - 3-ピラゾリル
2218 N	CH	CH	CH	5 - (5-メトキシ-3-ピリジル) - 3-ピラゾリル
2219 N	CH	CH	CH	5 - (2-キノリル) - 3-ピラゾリル
2220 N	CH	CH	CH	5 - (3-キノリル) - 3-ピラゾリル
2221 N	CH	CH	CH	2-エチル-4-チアゾリル
2222 N	CH	CH	CH	4-フェニル-2-チアゾリル
2223 N	CH	CH	CH	5-フェニル-2-チアゾリル
2224 N	CH	CH	CH	5 - (3-クロロフェニル) - 2-チアゾリル
2225 N	CH	CH	CH	5 - (4-クロロフェニル) - 2-チアゾリル
2226 N	CH	CH	CH	5 - (4-メトキシフェニル) - 2-チアゾリル
2227 N	CH	CH	CH	5 - (2-ピリジル) - 2-チアゾリル
2228 N	CH	CH	CH	4-フェニル-2-オキサゾリル
2229 N	CH	CH	CH	5-フェニル-2-オキサゾリル
2230 N	CH	CH	CH	4 - (3-メトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
2231 N	CH	CH	CH	4 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
2232 N	CH	CH	CH	4 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
2233 N	CH	CH	CH	3-フェニル-5-イソキサゾリル
2234 N	CH	CH	CH	3 - (2-クロロフェニル) - 5-イソキサゾリル
2235 N	CH	CH	CH	3 - (3-クロロフェニル) - 5-イソキサゾリル
2236 N	CH	CH	CH	3 - (4-クロロフェニル) - 5-イソキサゾリル
2237 N	CH	CH	CH	3 - (2-ピリジル) - 5-イソキサゾリル
2238 N	CH	CH	CH	5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
2239 N	CH	CH	CH	5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル

(表 8 の続き)

2240 N	CH	CH	CH	5 - (3-クロロフェニル) - 1, 3, 4-チアアジアゾール-2-イル
2241 N	CH	CH	CH	5 - (2-ビリジル) - 1, 3, 4-チアアジアゾール-2-イル
2242 N	CH	CH	CH	5 - (2-エチル-4-ビリジル) - 1, 3, 4-チアアジアゾール-2-イル
2243 N	CH	CH	CH	5-フェニル-2-ビリジル
2244 N	CH	CH	CH	5-フェニル-3-ビリジル
2245 N	CH	CH	CH	6-フェニル-3-ビリジル
2246 N	CH	CH	CH	2-フェニル-4-ビリジル
2247 N	CH	CH	CH	5 - (2-ビリジル) - 2-ビリジル
2248 N	CH	CH	CH	5-ベンゾイル-2-ビリジル
2249 N	CH	CH	CH	6-ベンゾイル-3-ビリジル
2250 N	CH	CH	CH	5-クロロ-2-ピラジニル
2251 N	CH	CH	CH	5 - (1-メチルピニル) - 2-ピラジニル
2252 N	CH	CH	CH	5 - (2-メチル-1-プロペニル) - 2-ピラジニル
2253 N	CH	CH	CH	5-アセチル-2-ピラジニル
2254 N	CH	CH	CH	5-プロピオニル-2-ピラジニル
2255 N	CH	CH	CH	5-フェニル-2-ピラジニル
2256 N	CH	CH	CH	5 - (3-フルオロフェニル) - 2-ピラジニル
2257 N	CH	CH	CH	5 - (2-クロロフェニル) - 2-ピラジニル
2258 N	CH	CH	CH	5 - (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピラジニル
2259 N	CH	CH	CH	5 - (4-ヒドロキシフェニル) - 2-ピラジニル
2260 N	CH	CH	CH	5 - (2-メトキシフェニル) - 2-ピラジニル
2261 N	CH	CH	CH	5 - (1, 2, 4-チアアジアゾール-5-イル) - 2-ピラジニル
2262 N	CH	CH	CH	5 - (1, 3, 4-チアアジアゾール-2-イル) - 2-ピラジニル
2263 N	CH	CH	CH	5 - (2-ビリジル) - 2-ピラジニル
2264 N	CH	CH	CH	5 - (3-ビリジル) - 2-ピラジニル
2265 N	CH	CH	CH	5 - (5-ビリミジニル) - 2-ピラジニル
2266 N	CH	CH	CH	5 - (3-キノリル) - 2-ピラジニル
2267 N	CH	CH	CH	5-ベンゾイル-2-ピラジニル
2268 N	CH	CH	CH	5 - (2-ビリジルカルボニル) - 2-ピラジニル
2269 N	CH	CH	CH	5-アセチル-2-ビリミジニル
2270 N	CH	CH	CH	5-アセチル-3-メチル-2-ビリミジニル
2271 N	CH	CH	CH	4-フェニル-2-ビリミジニル
2272 N	CH	CH	CH	5-フェニル-2-ビリミジニル
2273 N	CH	CH	CH	2-フェニル-4-ビリミジニル
2274 N	CH	CH	CH	6-フェニル-4-ビリミジニル
2275 N	CH	CH	CH	2-フェニル-5-ビリミジニル
2276 N	CH	CH	CH	5 - (2-フルオロフェニル) - 2-ビリミジニル
2277 N	CH	CH	CH	5 - (3-フルオロフェニル) - 2-ビリミジニル
2278 N	CH	CH	CH	5 - (4-フルオロフェニル) - 2-ビリミジニル
2279 N	CH	CH	CH	5 - (2-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル



## (表8の続き)

2280 N	CH	CH	CH	5 - (3-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル
2281 N	CH	CH	CH	5 - (4-クロロフェニル) - 2-ビリミジニル
2282 N	CH	CH	CH	5 - (2-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル
2283 N	CH	CH	CH	5 - (3-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル
2284 N	CH	CH	CH	5 - (2-フルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
2285 N	CH	CH	CH	5 - (3-フルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
2286 N	CH	CH	CH	5 - (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
2287 N	CH	CH	CH	5 - (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
2288 N	CH	CH	CH	5 - (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
2289 N	CH	CH	CH	5 - (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
2290 N	CH	CH	CH	5 - (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ビリミジニル
2291 N	CH	CH	CH	5 - (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ビリミジニル
2292 N	CH	CH	CH	5 - (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ビリミジニル
2293 N	CH	CH	CH	5 - (2-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル
2294 N	CH	CH	CH	5 - (3-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル
2295 N	CH	CH	CH	5 - (4-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル
2296 N	CH	CH	CH	5 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-ビリミジニル
2297 N	CH	CH	CH	5 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-ビリミジニル
2298 N	CH	CH	CH	5 - (2-フルオロ-5-メチルフェニル) - 2-ビリミジニル
2299 N	CH	CH	CH	5 - (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) - 2-ビリミジニル
2300 N	CH	CH	CH	6-フェニル-3-ビリダジニル
2301 N	CH	CH	CH	6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
2302 N	CH	CH	CH	5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
2303 N	CH	CH	CH	4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
2304 N	CH	CH	CH	2-ベンゾチアゾリル
2305 N	CH	CH	CH	5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
2306 N	CH	CH	CH	4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
2307 N	CH	CH	CH	6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
2308 N	CH	CH	CH	4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
2309 N	CH	CH	CH	2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
2310 N	CH	CH	CH	4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
2311 N	CH	CH	CH	5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
2312 N	CH	CH	CH	6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル
2313 N	CH	CH	CH	3-キノリル
2314 N	CH	CH	CH	6-キノリル
2315 N	CH	CH	CH	6-メチル-2-キノリル
2316 N	CH	CH	CH	7-メチル-2-キノリル
2317 N	CH	CH	CH	8-メチル-2-キノリル
2318 N	CH	CH	CH	2-メチル-6-キノリル
2319 N	CH	CH	CH	6-クロロ-2-キノキサリニル

(表 8 の続き)

2320	N	CH	CH	CH	7-クロロ-2-キノキサリニル
2321	N	CH	CH	CH	6-メチル-2-キノキサリニル
2322	N	CH	CH	CH	1, 5-ナフチリジン-2-イル
2323	N	CH	CH	CH	7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2324	N	CH	CH	CH	7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2325	N	CH	CH	CH	7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2326	N	CH	CH	CH	7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2327	N	CH	CH	CH	7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2328	CH	N	CH	CH	3-フルオロフェニル
2329	CH	N	CH	CH	4-フルオロフェニル
2330	CH	N	CH	CH	3, 4-ジフルオロフェニル
2331	CH	N	CH	CH	3-クロロフェニル
2332	CH	N	CH	CH	4-クロロフェニル
2333	CH	N	CH	CH	3, 4-ジクロロフェニル
2334	CH	N	CH	CH	4-アセチルフェニル
2335	CH	N	CH	CH	5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
2336	CH	N	CH	CH	4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
2337	CH	N	CH	CH	2-ビフェニリル
2338	CH	N	CH	CH	3-ビフェニリル
2339	CH	N	CH	CH	4-ビフェニリル
2340	CH	N	CH	CH	4- (1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
2341	CH	N	CH	CH	4- (1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
2342	CH	N	CH	CH	4- (2-チアゾリル) フェニル
2343	CH	N	CH	CH	4- (2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
2344	CH	N	CH	CH	3- (2-ピリジル) フェニル
2345	CH	N	CH	CH	3- (4-ピリジル) フェニル
2346	CH	N	CH	CH	4- (2-ピリジル) フェニル
2347	CH	N	CH	CH	4- (3-ピリジル) フェニル
2348	CH	N	CH	CH	4- (4-ピリジル) フェニル
2349	CH	N	CH	CH	4- (2-エチル-4-ピリジル) フェニル
2350	CH	N	CH	CH	4- (4-ピリジニル) フェニル
2351	CH	N	CH	CH	4-ベンゾイルフェニル
2352	CH	N	CH	CH	4- (2-ピリジルカルボニル) フェニル
2353	CH	N	CH	CH	1-ナフチル
2354	CH	N	CH	CH	9-オキソ-3-フルオレニル
2355	CH	N	CH	CH	1-メチル-2-イミダゾリル
2356	CH	N	CH	CH	1-フェニル-4-イミダゾリル
2357	CH	N	CH	CH	1- (2-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
2358	CH	N	CH	CH	1- (3-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
2359	CH	N	CH	CH	1- (4-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル

(表 8 の続き)

2360	CH	N	CH	CH	1 - (2, 3-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル
2361	CH	N	CH	CH	1 - (2, 4-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル
2362	CH	N	CH	CH	1 - (3, 5-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル
2363	CH	N	CH	CH	1 - (3-クロロフェニル) - 4-イミダゾリル
2364	CH	N	CH	CH	1 - (2-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル
2365	CH	N	CH	CH	1 - (3-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル
2366	CH	N	CH	CH	1 - (4-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル
2367	CH	N	CH	CH	1 - (3-トリフルオロメチルフェニル) - 4-イミダゾリル
2368	CH	N	CH	CH	1 - [3 - (2-ヒドロキシエチル) フェニル] - 4-イミダゾリル
2369	CH	N	CH	CH	1 - [3 - (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] - 4-イミダゾリル
2370	CH	N	CH	CH	1 - (3-メトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
2371	CH	N	CH	CH	1 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
2372	CH	N	CH	CH	1 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
2373	CH	N	CH	CH	1 - (4-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
2374	CH	N	CH	CH	1 - (2-ピリジル) - 4-イミダゾリル
2375	CH	N	CH	CH	1 - (4-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル
2376	CH	N	CH	CH	1 - (5-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル
2377	CH	N	CH	CH	1 - (7-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル
2378	CH	N	CH	CH	1 - (2-キノリル) - 4-イミダゾリル
2379	CH	N	CH	CH	1 - (3-キノリル) - 4-イミダゾリル
2380	CH	N	CH	CH	1 - (4-キノリル) - 4-イミダゾリル
2381	CH	N	CH	CH	1 - (5-キノリル) - 4-イミダゾリル
2382	CH	N	CH	CH	1 - (6-キノリル) - 4-イミダゾリル
2383	CH	N	CH	CH	1 - (8-キノリル) - 4-イミダゾリル
2384	CH	N	CH	CH	1-フェニル-3-ピラゾリル
2385	CH	N	CH	CH	5-フェニル-3-ピラゾリル
2386	CH	N	CH	CH	5 - (2-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
2387	CH	N	CH	CH	5 - (3-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
2388	CH	N	CH	CH	5 - (4-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
2389	CH	N	CH	CH	5 - (2-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
2390	CH	N	CH	CH	5 - (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
2391	CH	N	CH	CH	5 - (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
2392	CH	N	CH	CH	5 - (3-メトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
2393	CH	N	CH	CH	5 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
2394	CH	N	CH	CH	5 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
2395	CH	N	CH	CH	2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
2396	CH	N	CH	CH	5 - (2-ピリジル) - 3-ピラゾリル
2397	CH	N	CH	CH	5 - (5-メトキシ-3-ピリジル) - 3-ピラゾリル
2398	CH	N	CH	CH	5 - (2-キノリル) - 3-ピラゾリル
2399	CH	N	CH	CH	5 - (3-キノリル) - 3-ピラゾリル

(表 8 の続き)

2400	CH	N	CH	CH	2-エチル-4-チアゾリル
2401	CH	N	CH	CH	4-フェニル-2-チアゾリル
2402	CH	N	CH	CH	5-フェニル-2-チアゾリル
2403	CH	N	CH	CH	5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル
2404	CH	N	CH	CH	5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル
2405	CH	N	CH	CH	5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル
2406	CH	N	CH	CH	5-(2-ビリジル)-2-チアゾリル
2407	CH	N	CH	CH	4-フェニル-2-オキサゾリル
2408	CH	N	CH	CH	5-フェニル-2-オキサゾリル
2409	CH	N	CH	CH	4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル
2410	CH	N	CH	CH	4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
2411	CH	N	CH	CH	4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
2412	CH	N	CH	CH	3-フェニル-5-イソオキサゾリル
2413	CH	N	CH	CH	3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
2414	CH	N	CH	CH	3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
2415	CH	N	CH	CH	3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
2416	CH	N	CH	CH	3-(2-ビリジル)-5-イソオキサゾリル
2417	CH	N	CH	CH	5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
2418	CH	N	CH	CH	5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2419	CH	N	CH	CH	5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2420	CH	N	CH	CH	5-(2-ビリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2421	CH	N	CH	CH	5-(2-エチル-4-ビリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2422	CH	N	CH	CH	5-フェニル-2-ビリジル
2423	CH	N	CH	CH	5-フェニル-3-ビリジル
2424	CH	N	CH	CH	6-フェニル-3-ビリジル
2425	CH	N	CH	CH	2-フェニル-4-ビリジル
2426	CH	N	CH	CH	5-(2-ビリジル)-2-ビリジル
2427	CH	N	CH	CH	5-ベンゾイル-2-ビリジル
2428	CH	N	CH	CH	6-ベンゾイル-3-ビリジル
2429	CH	N	CH	CH	5-クロロ-2-ピラジニル
2430	CH	N	CH	CH	5-(1-メチルピニル)-2-ピラジニル
2431	CH	N	CH	CH	5-(2-メチル-1-プロベニル)-2-ピラジニル
2432	CH	N	CH	CH	5-アセチル-2-ピラジニル
2433	CH	N	CH	CH	5-プロピオニル-2-ピラジニル
2434	CH	N	CH	CH	5-フェニル-2-ピラジニル
2435	CH	N	CH	CH	5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル
2436	CH	N	CH	CH	5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル
2437	CH	N	CH	CH	5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
2438	CH	N	CH	CH	5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
2439	CH	N	CH	CH	5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル

## (表8の続き)

2440	CH	N	CH	CH	5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル
2441	CH	N	CH	CH	5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル
2442	CH	N	CH	CH	5-(2-ビリジル)-2-ピラジニル
2443	CH	N	CH	CH	5-(3-ビリジル)-2-ピラジニル
2444	CH	N	CH	CH	5-(5-ビリミジニル)-2-ピラジニル
2445	CH	N	CH	CH	5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
2446	CH	N	CH	CH	5-ベンゾイル-2-ピラジニル
2447	CH	N	CH	CH	5-(2-ビリジルカルボニル)-2-ピラジニル
2448	CH	N	CH	CH	5-アセチル-2-ビリミジニル
2449	CH	N	CH	CH	5-アセチル-3-メチル-2-ビリミジニル
2450	CH	N	CH	CH	4-フェニル-2-ビリミジニル
2451	CH	N	CH	CH	5-フェニル-2-ビリミジニル
2452	CH	N	CH	CH	2-フェニル-4-ビリミジニル
2453	CH	N	CH	CH	6-フェニル-4-ビリミジニル
2454	CH	N	CH	CH	2-フェニル-5-ビリミジニル
2455	CH	N	CH	CH	5-(2-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
2456	CH	N	CH	CH	5-(3-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
2457	CH	N	CH	CH	5-(4-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
2458	CH	N	CH	CH	5-(2-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
2459	CH	N	CH	CH	5-(3-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
2460	CH	N	CH	CH	5-(4-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
2461	CH	N	CH	CH	5-(2-メチルフェニル)-2-ビリミジニル
2462	CH	N	CH	CH	5-(3-メチルフェニル)-2-ビリミジニル
2463	CH	N	CH	CH	5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2464	CH	N	CH	CH	5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2465	CH	N	CH	CH	5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2466	CH	N	CH	CH	5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2467	CH	N	CH	CH	5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2468	CH	N	CH	CH	5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2469	CH	N	CH	CH	5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2470	CH	N	CH	CH	5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ビリミジニル
2471	CH	N	CH	CH	5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ビリミジニル
2472	CH	N	CH	CH	5-(2-メトキシフェニル)-2-ビリミジニル
2473	CH	N	CH	CH	5-(3-メトキシフェニル)-2-ビリミジニル
2474	CH	N	CH	CH	5-(4-メトキシフェニル)-2-ビリミジニル
2475	CH	N	CH	CH	5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ビリミジニル
2476	CH	N	CH	CH	5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ビリミジニル
2477	CH	N	CH	CH	5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ビリミジニル
2478	CH	N	CH	CH	5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ビリミジニル
2479	CH	N	CH	CH	6-フェニル-3-ビリダジニル

## (表 8 の続き)

2480	CH	N	CH	CH	6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
2481	CH	N	CH	CH	5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル
2482	CH	N	CH	CH	4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
2483	CH	N	CH	CH	2-ベンゾチアゾリル
2484	CH	N	CH	CH	5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
2485	CH	N	CH	CH	4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
2486	CH	N	CH	CH	6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
2487	CH	N	CH	CH	4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
2488	CH	N	CH	CH	2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
2489	CH	N	CH	CH	4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
2490	CH	N	CH	CH	5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
2491	CH	N	CH	CH	6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル
2492	CH	N	CH	CH	3-キノリル
2493	CH	N	CH	CH	6-キノリル
2494	CH	N	CH	CH	6-メチル-2-キノリル
2495	CH	N	CH	CH	7-メチル-2-キノリル
2496	CH	N	CH	CH	8-メチル-2-キノリル
2497	CH	N	CH	CH	2-メチル-6-キノリル
2498	CH	N	CH	CH	6-クロロ-2-キノキサリニル
2499	CH	N	CH	CH	7-クロロ-2-キノキサリニル
2500	CH	N	CH	CH	6-メチル-2-キノキサリニル
2501	CH	N	CH	CH	1, 5-ナフチリジン-2-イル
2502	CH	N	CH	CH	7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2503	CH	N	CH	CH	7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2504	CH	N	CH	CH	7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2505	CH	N	CH	CH	7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2506	CH	N	CH	CH	7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2507	CH	CH	N	CH	3-フルオロフェニル
2508	CH	CH	N	CH	4-フルオロフェニル
2509	CH	CH	N	CH	3, 4-ジフルオロフェニル
2510	CH	CH	N	CH	3-クロロフェニル
2511	CH	CH	N	CH	4-クロロフェニル
2512	CH	CH	N	CH	3, 4-ジクロロフェニル
2513	CH	CH	N	CH	4-アセチルフェニル
2514	CH	CH	N	CH	5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
2515	CH	CH	N	CH	4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
2516	CH	CH	N	CH	2-ビフェニル
2517	CH	CH	N	CH	3-ビフェニル
2518	CH	CH	N	CH	4-ビフェニル
2519	CH	CH	N	CH	4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル

(表 8 の続き)

2520	CH	CH	N	CH	4- (1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
2521	CH	CH	N	CH	4- (2-チアゾリル) フェニル
2522	CH	CH	N	CH	4- (2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
2523	CH	CH	N	CH	3- (2-ビリジル) フェニル
2524	CH	CH	N	CH	3- (4-ビリジル) フェニル
2525	CH	CH	N	CH	4- (2-ビリジル) フェニル
2526	CH	CH	N	CH	4- (3-ビリジル) フェニル
2527	CH	CH	N	CH	4- (4-ビリジル) フェニル
2528	CH	CH	N	CH	4- (2-エチル-4-ビリジル) フェニル
2529	CH	CH	N	CH	4- (4-ビリミジニル) フェニル
2530	CH	CH	N	CH	4-ベンゾイルフェニル
2531	CH	CH	N	CH	4- (2-ビリジルカルボニル) フェニル
2532	CH	CH	N	CH	1-ナフチル
2533	CH	CH	N	CH	9-オキソ-3-フルオレニル
2534	CH	CH	N	CH	1-メチル-2-イミダゾリル
2535	CH	CH	N	CH	1-フェニル-4-イミダゾリル
2536	CH	CH	N	CH	1- (2-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
2537	CH	CH	N	CH	1- (3-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
2538	CH	CH	N	CH	1- (4-フルオロフェニル) -4-イミダゾリル
2539	CH	CH	N	CH	1- (2, 3-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル
2540	CH	CH	N	CH	1- (2, 4-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル
2541	CH	CH	N	CH	1- (3, 5-ジフルオロフェニル) -4-イミダゾリル
2542	CH	CH	N	CH	1- (3-クロロフェニル) -4-イミダゾリル
2543	CH	CH	N	CH	1- (2-シアノフェニル) -4-イミダゾリル
2544	CH	CH	N	CH	1- (3-シアノフェニル) -4-イミダゾリル
2545	CH	CH	N	CH	1- (4-シアノフェニル) -4-イミダゾリル
2546	CH	CH	N	CH	1- (3-トリフルオロメチルフェニル) -4-イミダゾリル
2547	CH	CH	N	CH	1- [3- (2-ヒドロキシエチル) フェニル] -4-イミダゾリル
2548	CH	CH	N	CH	1- [3- (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] -4-イミダゾリル
2549	CH	CH	N	CH	1- (3-メトキシフェニル) -4-イミダゾリル
2550	CH	CH	N	CH	1- (2-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル
2551	CH	CH	N	CH	1- (3-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル
2552	CH	CH	N	CH	1- (4-ジフルオロメトキシフェニル) -4-イミダゾリル
2553	CH	CH	N	CH	1- (2-ビリジル) -4-イミダゾリル
2554	CH	CH	N	CH	1- (4-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル
2555	CH	CH	N	CH	1- (5-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル
2556	CH	CH	N	CH	1- (7-ベンゾ [b] フラニル) -4-イミダゾリル
2557	CH	CH	N	CH	1- (2-キノリル) -4-イミダゾリル
2558	CH	CH	N	CH	1- (3-キノリル) -4-イミダゾリル
2559	CH	CH	N	CH	1- (4-キノリル) -4-イミダゾリル

## (表 8 の続き)

2560	CH	CH	N	CH	1 - (5-キノリル) - 4-イミダゾリル
2561	CH	CH	N	CH	1 - (6-キノリル) - 4-イミダゾリル
2562	CH	CH	N	CH	1 - (8-キノリル) - 4-イミダゾリル
2563	CH	CH	N	CH	1-フェニル-3-ピラゾリル
2564	CH	CH	N	CH	5-フェニル-3-ピラゾリル
2565	CH	CH	N	CH	5 - (2-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
2566	CH	CH	N	CH	5 - (3-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
2567	CH	CH	N	CH	5 - (4-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
2568	CH	CH	N	CH	5 - (2-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
2569	CH	CH	N	CH	5 - (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
2570	CH	CH	N	CH	5 - (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
2571	CH	CH	N	CH	5 - (3-メトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
2572	CH	CH	N	CH	5 - (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
2573	CH	CH	N	CH	5 - (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
2574	CH	CH	N	CH	2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
2575	CH	CH	N	CH	5 - (2-ピリジル) - 3-ピラゾリル
2576	CH	CH	N	CH	5 - (5-メトキシ-3-ピリジル) - 3-ピラゾリル
2577	CH	CH	N	CH	5 - (2-キノリル) - 3-ピラゾリル
2578	CH	CH	N	CH	5 - (3-キノリル) - 3-ピラゾリル
2579	CH	CH	N	CH	2-エチル-4-チアゾリル
2580	CH	CH	N	CH	4-フェニル-2-チアゾリル
2581	CH	CH	N	CH	5-フェニル-2-チアゾリル
2582	CH	CH	N	CH	5 - (3-クロロフェニル) - 2-チアゾリル
2583	CH	CH	N	CH	5 - (4-クロロフェニル) - 2-チアゾリル
2584	CH	CH	N	CH	5 - (4-メトキシフェニル) - 2-チアゾリル
2585	CH	CH	N	CH	5 - (2-ピリジル) - 2-チアゾリル
2586	CH	CH	N	CH	4-フェニル-2-オキサゾリル
2587	CH	CH	N	CH	5-フェニル-2-オキサゾリル
2588	CH	CH	N	CH	4 - (3-メトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
2589	CH	CH	N	CH	4 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
2590	CH	CH	N	CH	4 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-オキサゾリル
2591	CH	CH	N	CH	3-フェニル-5-イソオキサゾリル
2592	CH	CH	N	CH	3 - (2-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
2593	CH	CH	N	CH	3 - (3-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
2594	CH	CH	N	CH	3 - (4-クロロフェニル) - 5-イソオキサゾリル
2595	CH	CH	N	CH	3 - (2-ピリジル) - 5-イソオキサゾリル
2596	CH	CH	N	CH	5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
2597	CH	CH	N	CH	5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2598	CH	CH	N	CH	5 - (3-クロロフェニル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2599	CH	CH	N	CH	5 - (2-ピリジル) - 1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル



(表 8 の続き)

2600	CH	CH	N	CH	5-(2-エチル-4-ピリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2601	CH	CH	N	CH	5-フェニル-2-ピリジル
2602	CH	CH	N	CH	5-フェニル-3-ピリジル
2603	CH	CH	N	CH	6-フェニル-3-ピリジル
2604	CH	CH	N	CH	2-フェニル-4-ピリジル
2605	CH	CH	N	CH	5-(2-ピリジル)-2-ピリジル
2606	CH	CH	N	CH	5-ベンゾイル-2-ピリジル
2607	CH	CH	N	CH	6-ベンゾイル-3-ピリジル
2608	CH	CH	N	CH	5-クロロ-2-ピラジニル
2609	CH	CH	N	CH	5-(1-メチルピニル)-2-ピラジニル
2610	CH	CH	N	CH	5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ピラジニル
2611	CH	CH	N	CH	5-アセチル-2-ピラジニル
2612	CH	CH	N	CH	5-プロピオニル-2-ピラジニル
2613	CH	CH	N	CH	5-フェニル-2-ピラジニル
2614	CH	CH	N	CH	5-(3-フルオロフェニル)-2-ピラジニル
2615	CH	CH	N	CH	5-(2-クロロフェニル)-2-ピラジニル
2616	CH	CH	N	CH	5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
2617	CH	CH	N	CH	5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ピラジニル
2618	CH	CH	N	CH	5-(2-メトキシフェニル)-2-ピラジニル
2619	CH	CH	N	CH	5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ピラジニル
2620	CH	CH	N	CH	5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ピラジニル
2621	CH	CH	N	CH	5-(2-ピリジル)-2-ピラジニル
2622	CH	CH	N	CH	5-(3-ピリジル)-2-ピラジニル
2623	CH	CH	N	CH	5-(5-ピリミジニル)-2-ピラジニル
2624	CH	CH	N	CH	5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
2625	CH	CH	N	CH	5-ベンゾイル-2-ピラジニル
2626	CH	CH	N	CH	5-(2-ピリジルカルボニル)-2-ピラジニル
2627	CH	CH	N	CH	5-アセチル-2-ピリミジニル
2628	CH	CH	N	CH	5-アセチル-3-メチル-2-ピリミジニル
2629	CH	CH	N	CH	4-フェニル-2-ピリミジニル
2630	CH	CH	N	CH	5-フェニル-2-ピリミジニル
2631	CH	CH	N	CH	2-フェニル-4-ピリミジニル
2632	CH	CH	N	CH	6-フェニル-4-ピリミジニル
2633	CH	CH	N	CH	2-フェニル-5-ピリミジニル
2634	CH	CH	N	CH	5-(2-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
2635	CH	CH	N	CH	5-(3-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
2636	CH	CH	N	CH	5-(4-フルオロフェニル)-2-ピリミジニル
2637	CH	CH	N	CH	5-(2-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
2638	CH	CH	N	CH	5-(3-クロロフェニル)-2-ピリミジニル
2639	CH	CH	N	CH	5-(4-クロロフェニル)-2-ピリミジニル

## (表 8 の続き)

2640	CH	CH	N	CH	5 - (2-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル
2641	CH	CH	N	CH	5 - (3-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル
2642	CH	CH	N	CH	5 - (2-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
2643	CH	CH	N	CH	5 - (3-フルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
2644	CH	CH	N	CH	5 - (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
2645	CH	CH	N	CH	5 - (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
2646	CH	CH	N	CH	5 - (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
2647	CH	CH	N	CH	5 - (2-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
2648	CH	CH	N	CH	5 - (3-ヒドロキシメチルフェニル) - 2-ピリミジニル
2649	CH	CH	N	CH	5 - (2-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル
2650	CH	CH	N	CH	5 - (3-ヒドロキシフェニル) - 2-ピリミジニル
2651	CH	CH	N	CH	5 - (2-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
2652	CH	CH	N	CH	5 - (3-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
2653	CH	CH	N	CH	5 - (4-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
2654	CH	CH	N	CH	5 - (2-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
2655	CH	CH	N	CH	5 - (3-フルオロメトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
2656	CH	CH	N	CH	5 - (2-フルオロ-5-メチルフェニル) - 2-ピリミジニル
2657	CH	CH	N	CH	5 - (3-フルオロ-5-メトキシフェニル) - 2-ピリミジニル
2658	CH	CH	N	CH	6-フェニル-3-ピリダジニル
2659	CH	CH	N	CH	6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
2660	CH	CH	N	CH	5-クロロ-2-ベンゾキサゾリル
2661	CH	CH	N	CH	4-メトキシ-2-ベンゾキサゾリル
2662	CH	CH	N	CH	2-ベンゾチアゾリル
2663	CH	CH	N	CH	5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
2664	CH	CH	N	CH	4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
2665	CH	CH	N	CH	6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
2666	CH	CH	N	CH	4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
2667	CH	CH	N	CH	2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
2668	CH	CH	N	CH	4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
2669	CH	CH	N	CH	5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
2670	CH	CH	N	CH	6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル
2671	CH	CH	N	CH	3-キノリル
2672	CH	CH	N	CH	6-キノリル
2673	CH	CH	N	CH	6-メチル-2-キノリル
2674	CH	CH	N	CH	7-メチル-2-キノリル
2675	CH	CH	N	CH	8-メチル-2-キノリル
2676	CH	CH	N	CH	2-メチル-6-キノリル
2677	CH	CH	N	CH	6-クロロ-2-キノキサリニル
2678	CH	CH	N	CH	7-クロロ-2-キノキサリニル
2679	CH	CH	N	CH	6-メチル-2-キノキサリニル

(表 8 の続き)

2680	CH	CH	N	CH	1, 5-ナフチリジン-2-イル
2681	CH	CH	N	CH	7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2682	CH	CH	N	CH	7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2683	CH	CH	N	CH	7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2684	CH	CH	N	CH	7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2685	CH	CH	N	CH	7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2686	CH	CH	CH	N	3-フルオロフェニル
2687	CH	CH	CH	N	4-フルオロフェニル
2688	CH	CH	CH	N	3, 4-ジフルオロフェニル
2689	CH	CH	CH	N	3-クロロフェニル
2690	CH	CH	CH	N	4-クロロフェニル
2691	CH	CH	CH	N	3, 4-ジクロロフェニル
2692	CH	CH	CH	N	4-アセチルフェニル
2693	CH	CH	CH	N	5-オキソ-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-2-ナフチル
2694	CH	CH	CH	N	4-アセチル-3-トリフルオロメチルフェニル
2695	CH	CH	CH	N	2-ビフェニル
2696	CH	CH	CH	N	3-ビフェニル
2697	CH	CH	CH	N	4-ビフェニル
2698	CH	CH	CH	N	4-(1-メチル-2-イミダゾリル) フェニル
2699	CH	CH	CH	N	4-(1-エチル-2-イミダゾリル) フェニル
2700	CH	CH	CH	N	4-(2-チアゾリル) フェニル
2701	CH	CH	CH	N	4-(2-エチル-4-チアゾリル) フェニル
2702	CH	CH	CH	N	3-(2-ビリジル) フェニル
2703	CH	CH	CH	N	3-(4-ビリジル) フェニル
2704	CH	CH	CH	N	4-(2-ビリジル) フェニル
2705	CH	CH	CH	N	4-(3-ビリジル) フェニル
2706	CH	CH	CH	N	4-(4-ビリジル) フェニル
2707	CH	CH	CH	N	4-(2-エチル-4-ビリジル) フェニル
2708	CH	CH	CH	N	4-(4-ビリミジル) フェニル
2709	CH	CH	CH	N	4-ベンゾイルフェニル
2710	CH	CH	CH	N	4-(2-ビリジルカルボニル) フェニル
2711	CH	CH	CH	N	1-ナフチル
2712	CH	CH	CH	N	9-オキソ-3-フルオレニル
2713	CH	CH	CH	N	1-メチル-2-イミダゾリル
2714	CH	CH	CH	N	1-フェニル-4-イミダゾリル
2715	CH	CH	CH	N	1-(2-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
2716	CH	CH	CH	N	1-(3-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
2717	CH	CH	CH	N	1-(4-フルオロフェニル)-4-イミダゾリル
2718	CH	CH	CH	N	1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル
2719	CH	CH	CH	N	1-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-イミダゾリル

## (表 8 の続き)

2720	CH	CH	CH	N	1- (3, 5-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル
2721	CH	CH	CH	N	1- (3-クロロフェニル) - 4-イミダゾリル
2722	CH	CH	CH	N	1- (2-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル
2723	CH	CH	CH	N	1- (3-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル
2724	CH	CH	CH	N	1- (4-シアノフェニル) - 4-イミダゾリル
2725	CH	CH	CH	N	1- (3-トリフルオロメチルフェニル) - 4-イミダゾリル
2726	CH	CH	CH	N	1- [3- (2-ヒドロキシエチル) フェニル] - 4-イミダゾリル
2727	CH	CH	CH	N	1- [3- (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) フェニル] - 4-イミダゾリル
2728	CH	CH	CH	N	1- (3-メトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
2729	CH	CH	CH	N	1- (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
2730	CH	CH	CH	N	1- (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
2731	CH	CH	CH	N	1- (4-ジフルオロメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル
2732	CH	CH	CH	N	1- (2-ピリジル) - 4-イミダゾリル
2733	CH	CH	CH	N	1- (4-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル
2734	CH	CH	CH	N	1- (5-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル
2735	CH	CH	CH	N	1- (7-ベンゾ [b] フラニル) - 4-イミダゾリル
2736	CH	CH	CH	N	1- (2-キノリル) - 4-イミダゾリル
2737	CH	CH	CH	N	1- (3-キノリル) - 4-イミダゾリル
2738	CH	CH	CH	N	1- (4-キノリル) - 4-イミダゾリル
2739	CH	CH	CH	N	1- (5-キノリル) - 4-イミダゾリル
2740	CH	CH	CH	N	1- (6-キノリル) - 4-イミダゾリル
2741	CH	CH	CH	N	1- (8-キノリル) - 4-イミダゾリル
2742	CH	CH	CH	N	1-フェニル-3-ピラゾリル
2743	CH	CH	CH	N	5-フェニル-3-ピラゾリル
2744	CH	CH	CH	N	5- (2-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
2745	CH	CH	CH	N	5- (3-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
2746	CH	CH	CH	N	5- (4-フルオロフェニル) - 3-ピラゾリル
2747	CH	CH	CH	N	5- (2-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
2748	CH	CH	CH	N	5- (3-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
2749	CH	CH	CH	N	5- (4-クロロフェニル) - 3-ピラゾリル
2750	CH	CH	CH	N	5- (3-メトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
2751	CH	CH	CH	N	5- (2-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
2752	CH	CH	CH	N	5- (3-ジフルオロメトキシフェニル) - 3-ピラゾリル
2753	CH	CH	CH	N	2-メチル-5-フェニル-3-ピラゾリル
2754	CH	CH	CH	N	5- (2-ピリジル) - 3-ピラゾリル
2755	CH	CH	CH	N	5- (5-メトキシ-3-ピリジル) - 3-ピラゾリル
2756	CH	CH	CH	N	5- (2-キノリル) - 3-ピラゾリル
2757	CH	CH	CH	N	5- (3-キノリル) - 3-ピラゾリル
2758	CH	CH	CH	N	2-エチル-4-チアゾリル
2759	CH	CH	CH	N	4-フェニル-2-チアゾリル

## (表 8 の続き)

2760	CH	CH	CH	N	5-フェニル-2-チアゾリル
2761	CH	CH	CH	N	5-(3-クロロフェニル)-2-チアゾリル
2762	CH	CH	CH	N	5-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル
2763	CH	CH	CH	N	5-(4-メトキシフェニル)-2-チアゾリル
2764	CH	CH	CH	N	5-(2-ビリジル)-2-チアゾリル
2765	CH	CH	CH	N	4-フェニル-2-オキサゾリル
2766	CH	CH	CH	N	5-フェニル-2-オキサゾリル
2767	CH	CH	CH	N	4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル
2768	CH	CH	CH	N	4-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
2769	CH	CH	CH	N	4-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル
2770	CH	CH	CH	N	3-フェニル-5-イソオキサゾリル
2771	CH	CH	CH	N	3-(2-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
2772	CH	CH	CH	N	3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
2773	CH	CH	CH	N	3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル
2774	CH	CH	CH	N	3-(2-ビリジル)-5-イソオキサゾリル
2775	CH	CH	CH	N	5-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル
2776	CH	CH	CH	N	5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2777	CH	CH	CH	N	5-(3-クロロフェニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2778	CH	CH	CH	N	5-(2-ビリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2779	CH	CH	CH	N	5-(2-エチル-4-ビリジル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル
2780	CH	CH	CH	N	5-フェニル-2-ビリジル
2781	CH	CH	CH	N	5-フェニル-3-ビリジル
2782	CH	CH	CH	N	6-フェニル-3-ビリジル
2783	CH	CH	CH	N	2-フェニル-4-ビリジル
2784	CH	CH	CH	N	5-(2-ビリジル)-2-ビリジル
2785	CH	CH	CH	N	5-ベンゾイル-2-ビリジル
2786	CH	CH	CH	N	6-ベンゾイル-3-ビリジル
2787	CH	CH	CH	N	5-クロロ-2-ビラジニル
2788	CH	CH	CH	N	5-(1-メチルピニル)-2-ビラジニル
2789	CH	CH	CH	N	5-(2-メチル-1-プロペニル)-2-ビラジニル
2790	CH	CH	CH	N	5-アセチル-2-ビラジニル
2791	CH	CH	CH	N	5-プロピオニル-2-ビラジニル
2792	CH	CH	CH	N	5-フェニル-2-ビラジニル
2793	CH	CH	CH	N	5-(3-フルオロフェニル)-2-ビラジニル
2794	CH	CH	CH	N	5-(2-クロロフェニル)-2-ビラジニル
2795	CH	CH	CH	N	5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ビラジニル
2796	CH	CH	CH	N	5-(4-ヒドロキシフェニル)-2-ビラジニル
2797	CH	CH	CH	N	5-(2-メトキシフェニル)-2-ビラジニル
2798	CH	CH	CH	N	5-(1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-2-ビラジニル
2799	CH	CH	CH	N	5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-2-ビラジニル

## (表8の続き)

2800	CH	CH	CH	N	5-(2-ビリジル)-2-ピラジニル
2801	CH	CH	CH	N	5-(3-ビリジル)-2-ピラジニル
2802	CH	CH	CH	N	5-(5-ビリミジニル)-2-ピラジニル
2803	CH	CH	CH	N	5-(3-キノリル)-2-ピラジニル
2804	CH	CH	CH	N	5-ベンゾイル-2-ピラジニル
2805	CH	CH	CH	N	5-(2-ビリジルカルボニル)-2-ピラジニル
2806	CH	CH	CH	N	5-アセチル-2-ビリミジニル
2807	CH	CH	CH	N	5-アセチル-3-メチル-2-ビリミジニル
2808	CH	CH	CH	N	4-フェニル-2-ビリミジニル
2809	CH	CH	CH	N	5-フェニル-2-ビリミジニル
2810	CH	CH	CH	N	2-フェニル-4-ビリミジニル
2811	CH	CH	CH	N	6-フェニル-4-ビリミジニル
2812	CH	CH	CH	N	2-フェニル-5-ビリミジニル
2813	CH	CH	CH	N	5-(2-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
2814	CH	CH	CH	N	5-(3-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
2815	CH	CH	CH	N	5-(4-フルオロフェニル)-2-ビリミジニル
2816	CH	CH	CH	N	5-(2-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
2817	CH	CH	CH	N	5-(3-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
2818	CH	CH	CH	N	5-(4-クロロフェニル)-2-ビリミジニル
2819	CH	CH	CH	N	5-(2-メチルフェニル)-2-ビリミジニル
2820	CH	CH	CH	N	5-(3-メチルフェニル)-2-ビリミジニル
2821	CH	CH	CH	N	5-(2-フルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2822	CH	CH	CH	N	5-(3-フルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2823	CH	CH	CH	N	5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2824	CH	CH	CH	N	5-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2825	CH	CH	CH	N	5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2826	CH	CH	CH	N	5-(2-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2827	CH	CH	CH	N	5-(3-ヒドロキシメチルフェニル)-2-ビリミジニル
2828	CH	CH	CH	N	5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ビリミジニル
2829	CH	CH	CH	N	5-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ビリミジニル
2830	CH	CH	CH	N	5-(2-メトキシフェニル)-2-ビリミジニル
2831	CH	CH	CH	N	5-(3-メトキシフェニル)-2-ビリミジニル
2832	CH	CH	CH	N	5-(4-メトキシフェニル)-2-ビリミジニル
2833	CH	CH	CH	N	5-(2-フルオロメトキシフェニル)-2-ビリミジニル
2834	CH	CH	CH	N	5-(3-フルオロメトキシフェニル)-2-ビリミジニル
2835	CH	CH	CH	N	5-(2-フルオロ-5-メチルフェニル)-2-ビリミジニル
2836	CH	CH	CH	N	5-(3-フルオロ-5-メトキシフェニル)-2-ビリミジニル
2837	CH	CH	CH	N	6-フェニル-3-ビリダジニル
2838	CH	CH	CH	N	6-フェニル-1, 2, 4-トリアジン-3-イル
2839	CH	CH	CH	N	5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル

(表 8 の続き)

2840	CH	CH	CH	N	4-メトキシ-2-ベンゾオキサゾリル
2841	CH	CH	CH	N	2-ベンゾチアゾリル
2842	CH	CH	CH	N	5-フルオロ-2-ベンゾチアゾリル
2843	CH	CH	CH	N	4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
2844	CH	CH	CH	N	6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル
2845	CH	CH	CH	N	4-メチル-2-ベンゾチアゾリル
2846	CH	CH	CH	N	2-メチル-5-ベンゾチアゾリル
2847	CH	CH	CH	N	4-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
2848	CH	CH	CH	N	5-メトキシ-2-ベンゾチアゾリル
2849	CH	CH	CH	N	6-メトキシピリド [3, 2-d] チアゾール-2-イル
2850	CH	CH	CH	N	3-キノリル
2851	CH	CH	CH	N	6-キノリル
2852	CH	CH	CH	N	6-メチル-2-キノリル
2853	CH	CH	CH	N	7-メチル-2-キノリル
2854	CH	CH	CH	N	8-メチル-2-キノリル
2855	CH	CH	CH	N	2-メチル-6-キノリル
2856	CH	CH	CH	N	6-クロロ-2-キノキサリニル
2857	CH	CH	CH	N	7-クロロ-2-キノキサリニル
2858	CH	CH	CH	N	6-メチル-2-キノキサリニル
2859	CH	CH	CH	N	1, 5-ナフチリジン-2-イル
2860	CH	CH	CH	N	7-クロロ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2861	CH	CH	CH	N	7-メチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2862	CH	CH	CH	N	7-トリフルオロメチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2863	CH	CH	CH	N	7-ジフルオロメトキシ-1, 5-ナフチリジン-2-イル
2864	CH	CH	CH	N	7-アセチル-1, 5-ナフチリジン-2-イル

中でも、例えば、N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル] アセトアミド、

5 N-(2-ビフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル] アセトアミド、

N-(3-ビフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル] アセトアミド、

N-(4-ビフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル] アセトアミド、

10 N-(5-ベンゾイル-2-ピリジル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル] アセトアミド、

N-(3-クロロフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル] アセトアミド、

N- (4-クロロフェニル) - 2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] アセトアミド、

2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] - N- (5-フェニル-2-チアゾリル) アセトアミド、

5 2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] - N- (5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル) アセトアミド、

2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] - N- (5-フェニル-2-ピラジニル) アセトアミド、

10 2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] - N- (4-フェニル-2-チアゾリル) アセトアミド、

2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] - N- (3-フェニル-5-イソオキサゾリル) アセトアミド、

15 2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] - N- (2-フェニル-4-ピリミジニル) アセトアミド、

2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] - N- (4-フェニル-2-ピリミジニル) アセトアミド、

2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] - N- (1-フェニル-4-イミダゾリル) アセトアミド、

20 N- (6-メトキシ-7-アザベンゾチアゾール-2-イル) - 2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] アセトアミド、

N- (2-ベンゾチアゾリル) - 2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] アセトアミド、

25 N- (6-メチル-2-キノリル) - 2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] アセトアミド、

N- (4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル) - 2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4' -ピペリジン] - 1' -イル] アセトアミド、

N- (6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル) - 2 - [1-メチルスルホニルス



- ピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、  
2 - [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] -N- (1-ナフチル) アセトアミド、  
N- (5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル) -2- [1-メチルスルホニル  
5 スピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、  
N- (4-ベンゾイルフェニル) -2- [1-エチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、  
N- (4-ベンゾイルフェニル) -2- [1-アセチルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、  
10 N- (4-ベンゾイルフェニル) -2- [1-メチルスルホニルスピロ [7-アザインドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、  
N- (4-ベンゾイルフェニル) -2- [2-ヒドロキシ-1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、  
N- (4-ベンゾイルフェニル) -2- [3, 4-ジヒドロ-3-オキソスピ  
15 ロ [イソキノリン-1 (2H), 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、  
2 - [3, 4-ジヒドロ-3-オキソスピロ [イソキノリン-1 (2H), 4'-ビペリジン] -1'-イル] -N- (3-フェニル-5-イソオキサゾリル) アセトアミド、  
20 2 - [3-オキソスピロ [イソベンゾフラン-1 (3H), 4'-ビペリジン] -1'-イル] -N- (2-フェニル-4-ピリジル) アセトアミド、  
2 - [3-オキソスピロ [6-アザイソベンゾフラン-1 (3H), 4'-ビペリジン] -1'-イル] -N- (2-フェニル-4-ピリジル) アセトアミド、  
2 - [3-オキソスピロ [イソベンゾフラン-1 (3H), 4'-ビペリジン  
25 ] -1'-イル] -N- (1-フェニル-3-ピラゾリル) アセトアミド、  
N- (3-ピフェニル) -2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] -2-フェニルアセトアミド、  
N- (4-ベンゾイルフェニル) -2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] プロピオンアミド、

2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] -N- (1-フェニル-4-イミダゾリル) プロピオンアミド、

N- (3-ピフェニル) -2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] プチルアミド、

5 N- (4-ベンゾイルフェニル) -2-メチル-2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] プロピオンアミド、

N- (3-ピフェニル) -2-メチル-2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] プロピオンアミド、

10 2-メチル-2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] -N- (5-フェニル-3-ピリジル) プロピオンアミド、

2-メチル-2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] -N- (3-フェニル-5-イソオキサゾリル) プロピオンアミド又は

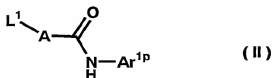
15 N- (4-ベンゾイルフェニル) -3- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] プロピオンアミド等が好適である。

次に、本発明に係る化合物の製造法について説明する。

本発明化合物 (I) は、例えば下記の製造法又は実施例に示す方法等により製造することができる。ただし、本発明化合物 (I) の製造法はこれら反例に限定されるものではない。

#### 製造法 1

一般式 (II)

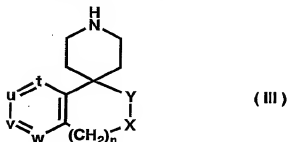


25 [式中、 $\text{Ar}^{1p}$  はハロゲン原子、ニトロ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボ

ニル基及び $-Q^{1p}-Ar^{2p}$ で表される基並びに保護されていてもよい、オキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基及びカルボキシル基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； $Ar^{2p}$ はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級アルコキシ基、

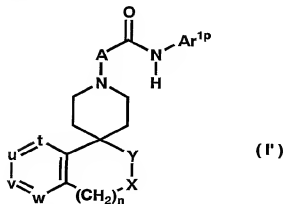
5 ハロ低級アルコキシ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基並びに保護されていてもよい、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基及び低級アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； $L^1$ は脱離基を意味し； $Q^{1p}$ は単結合又は保護されていてもよいカルボニル基を意味し、Aは前記の意味を有する]で表さ

10 れる化合物と、一般式 (I I I)



[式中、t、u、v及びwは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基及び低級アルコキシ基並びに保護されていてもよい水酸基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち

15 少なくとも2つが該メチン基を意味し、n、X及びYは前記の意味を有する]で表される化合物とを反応させ、一般式 (I')



[式中、A、 $Ar^{1p}$ 、n、t、u、v、w、X及びYは前記の意味を有する]で表される化合物とし、所望により保護基を除去することにより、一般式 (I) で

表される化合物を製造することができる。

L<sup>1</sup>で示される脱離基としては、例えば塩素原子、臭素原子若しくはヨウ素原子等のハロゲン原子、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基、ベンゼンスルホニル基等の有機スルホニル基又はメタンスルホニルオキシ基、トリフルオロメ  
5 タンスルホニルオキシ基、p-トルエンスルホニルオキシ基等の有機スルホニルオキシ基等が挙げられる。

上記反応において、反応物質中に反応に関与しないアミノ基、水酸基、カルボキシル基、オキシ基、カルボニル基等が存在する場合、当該アミノ基、水酸基、カルボキシル基、オキシ基、カルボニル基は、適宜、アミノ基の保護基、水酸基  
10 の保護基、カルボキシル基の保護基又はオキシ基若しくはカルボニル基の保護基で保護した後に反応を行い、反応後に当該保護基を除去することができる。

「アミノ基の保護基」としては、例えばベンジル基、p-メトキシベンジル基、3,4-ジメトキシベンジル基、o-ニトロベンジル基、p-ニトロベンジル基、ベンズヒドリル基、トリチル基等のアラルキル基；例えばホルミル基、アセチル  
15 基、プロピオニル基、ブチリル基、ピバロイル基等の低級アルカノイル基；例えばベンゾイル基；例えばフェニルアセチル基、フェノキシアセチル基等のアリーラルアルカノイル基；例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロピルオキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基等の低級アルコキシカルボニル基；例えばベンジロキシカルボニル基、p-ニトロベンジロキシカルボニル基、フェネチロキシカルボニル基等のアラルキルオキシカルボニル  
20 基；例えばトリメチルシリル基、tert-ブチルジメチルシリル基等の低級アルキルシリル基等が挙げられ、特にアセチル基、ピバロイル基、ベンゾイル基、エトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基等が好ましい。

「水酸基の保護基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソ  
25 プロピル基、tert-ブチル基等の低級アルキル基；例えばトリメチルシリル基、tert-ブチルジメチルシリル基等の低級アルキルシリル基；例えばメトキシメチル基、2-メトキシエトキシメチル基等の低級アルコキシメチル基；例えばテトラヒドロピラニル基；例えばトリメチルシリルエトキシメチル基；例えばベンジル基、p-メトキシベンジル基、2,3-ジメトキシベンジル基、o-

ニトロベンジル基、*p*-ニトロベンジル基、トリチル基等のアラルキル基；例えばホルミル基、アセチル基等のアシル基等が挙げられ、特にメチル基、メトキシメチル基、テトラヒドロピラニル基、トリチル基、トリメチルシリルエトキシメチル基、*tert*-ブチルジメチルシリル基、アセチル基等が好ましい。

- 5 「カルボキシル基の保護基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、*tert*-ブチル基等の低級アルキル基；例えば2, 2, 2-トリクロロエチル基等の低級ハロアルキル基；例えば2-プロペニル基等の低級アルケニル基；例えばベンジル基、*p*-メトキシベンジル基、*p*-ニトロベンジル基、ベンズヒドリル基、トリチル基等のアラルキル基等が挙げられ、特に
- 10 メチル基、エチル基、*tert*-ブチル基、2-プロペニル基、ベンジル基、*p*-メトキシベンジル基、ベンズヒドリル基等が好ましい。

「オキシ基又はカルボニル基の保護基」としては、エチレンケタール、トリメチレンケタール、ジメチルケタール等のアセタール、ケタール等が挙げられる。

- 一般式(I I)で表される化合物と一般式(I I I)で表される化合物との反
- 15 応は、通常、化合物(I I)の1モルに対して、化合物(I I I)を等モルないし過剰モル、好ましくは等モルないし1.5モル用いて行われる。

- 反応は、通常、不活性溶媒中で行われ、当該不活性溶媒としては、例えば水、塩化メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、アセトン、エチルメチルケトン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等又はその混合溶媒等が好
- 20 適である。

また、上記反応は塩基の存在下に行うことが好ましく、当該塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基又は炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基を使用することができる。

- 25 反応溶媒として、例えばテトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等を用いた場合は、塩基として水素化ナトリウム、水素化カリウム、ナトリウム*tert*-ブトキシド、カリウム*tert*-ブトキシド等の塩基を使用することができる。

当該塩基の使用量は、通常、一般式(I I)で表される化合物1モルに対して、

等モルないし過剰モル、好ましくは1ないし5モルである。

また、上記反応は無機ハロゲン化物の存在下に行うことができ、当該無機ハロゲン化物としては、例えば臭化リチウム、ヨウ化リチウム、臭化ナトリウム、ヨウ化ナトリウム、臭化カリウム、ヨウ化カリウム等が好適である。

- 5 当該無機ハロゲン化物の使用量は、通常、一般式 (I I) で表される化合物1モルに対して、0.05モルないし過剰モル、好ましくは0.2ないし5モルである。

反応温度は、通常、0℃ないし150℃、好ましくは20℃ないし100℃である。

- 10 反応時間は、通常、10分間ないし7日間、好ましくは30分間ないし24時間である。

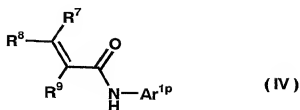
反応終了後、通常の処理を行い、一般式 (I') で表される化合物の粗生成物を得ることができる。このようにして得られた一般式 (I') で表される化合物を、常法に従って精製し、又は精製することなく、必要に応じて、アミノ基、水

15 酸基、カルボキシ基、オキソ基及びカルボニル基の保護基の除去反応を適宜組み合わせることで行うことにより、一般式 (I) の化合物を製造することができる。

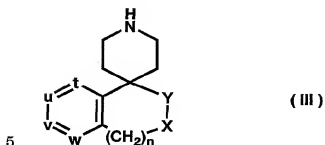
- 保護基の除去法は、当該保護基の種類及び目的化合物 (I) の安定性等により異なるが、例えば文献記載の方法 [プロテクトティブ・グループ・イン・オーガニック・シンセシス (Protective Groups in Organic Synthesis)、T. W. グリーン (T. W. Greene) 著、John Wiley & Sons 社 (1981年) 参照] 又はそれに準じる方法に従って、例えば酸又は塩基を用いる加溶媒分解、すなわち、例えば0.01モルないし大過剰の酸、好ましくはトリフルオロ酢酸、ギ酸、塩酸等、又は等
- 20 25 用させる方法; 水素化金属錯体等を用いる化学的還元又はパラジウム-炭素触媒、ラネーニッケル触媒等を用いる接触還元等により行われる。

## 製造法2

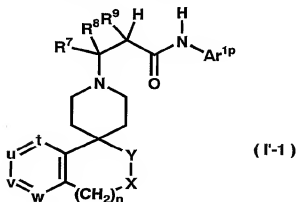
一般式 (I V)



〔式中、 $R^7$ 、 $R^8$ 及び $R^9$ は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基又はアラルキル基を意味し、 $Ar^{1p}$ は前記の意味を有する〕で表される化合物と、一般式 (III)



〔式中、 $n$ 、 $t$ 、 $u$ 、 $v$ 、 $w$ 、 $X$ 及び $Y$ は前記の意味を有する〕で表される化合物とを反応させ、一般式 (I'-1)



〔式中、 $Ar^{1p}$ 、 $n$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $t$ 、 $u$ 、 $v$ 、 $w$ 、 $X$ 及び $Y$ は前記の意味を有する〕で表される化合物とし、所望により保護基を除去することにより、一般式 (I-1)





間である。

反応終了後、生成物に保護基が存在する場合、当該保護基を除去した後に、又は生成物に保護基が存在しない場合はそのまま通常の処理を行い、一般式（I-1）の化合物を製造することができる。

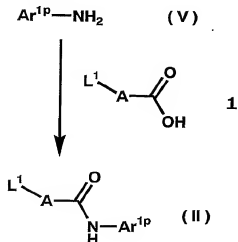
- 5 保護基の除去及び後処理等は、前記製造法1に記載した方法に準じて行うことができる。

一般式（I）又は（I-1）の化合物は、通常分離手段により容易に単離精製できる。かかる手段としては、例えば溶媒抽出、再結晶、カラムクロマトグラフィー、分取薄層クロマトグラフィー等を例示できる。

- 10 これらの化合物は、常法により医薬として許容されうる塩又はエステルとすることができ、また逆に塩又はエステルから遊離化合物への変換も常法に従って行うことができる。

一般式（I I）、（I I I）又は（I V）で表される化合物は、例えば市販品を用いるか、文献記載の方法【テトラヘドロン（Tetrahedron）、5  
15 3巻、10983頁（1997年）；WO00/27845号；WO01/14376号等参照】若しくはこれらの方法に準じる方法、あるいは以下の方法又は実施例に記載する方法等を必要に応じ適宜組み合わせることにより製造することができる。

#### 製造法A



[式中、A、Ar<sup>1p</sup>及びL<sup>1</sup>は前記の意味を有する]

本製造法は一般式 (I I) で表される化合物の製造法である。

一般式 (V) で表される化合物と一般式 1 で表されるカルボン酸との反応は、通常、一般式 (V) で表される化合物 1 モルに対して、一般式 1 で表されるカルボン酸を 0.5 モルないし過剰モル、好ましくは 1 モルないし 1.5 モル用いて  
5 行われる。

反応は、通常、不活性溶媒中で行われ、当該不活性溶媒としては、例えば塩化メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ピリジン等又はその混合溶媒等が好適である。

また、上記反応は縮合剤の存在下に行うことが好ましく、当該縮合剤としては、  
10 例えば N, N' - ジシクロヘキシルカルボジイミド、N, N' - ジイソプロピルカルボジイミド、1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド、1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩、ベンゾトリアゾール - 1 - イルオキシートリス - (ジメチルアミノ) ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、ベンゾトリアゾール - 1 - イルオキシートリス  
15 - ピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、プロモトリス - (ジメチルアミノ) ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、ジフェニルりん酸アジド、1, 1' - カルボニルジイミダゾール等を使用することができる。

当該縮合剤は、通常、一般式 1 で表される化合物 1 モルに対して、1 モルないし過剰モル、好ましくは 1 モルないし 1.5 モルを用いることができる。

20 反応温度は、通常、-50℃ないし 100℃、好ましくは -20℃ないし 50℃である。

反応時間は、通常、30 分間ないし 7 日間、好ましくは 1 時間ないし 24 時間である。

一般式 1 で表されるカルボン酸に代えて、該カルボン酸の反応性誘導体と一般式 (V) で表される化合物とを反応させることにより、一般式 (I I) で表される化合物を製造することもできる。

一般式 1 で表されるカルボン酸の反応性誘導体としては、例えば酸ハロゲン化物、混合酸無水物、活性エステル、活性アミド等が用いられる。

一般式 1 のカルボン酸の酸ハロゲン化物は、一般式 1 のカルボン酸を常法に従

ってハロゲン化剤と反応させることにより得ることができる。ハロゲン化剤としては、例えば塩化チオニル、三塩化りん、五塩化りん、オキシ塩化りん、三臭化りん、オキサリルクロリド、ホスゲン等が用いられる。

- 一般式 1 のカルボン酸の混合酸無水物は、一般式 1 のカルボン酸を常法に従って、例えばクロロ炭酸エチル等のクロロ炭酸アルキル；ピバロイルクロリド等の脂肪族カルボン酸クロリド等と反応させることにより得ることができる。

- 一般式 1 のカルボン酸の活性エステルは、一般式 1 のカルボン酸を常法に従って、例えばN, N' -ジシクロヘキシルカルボジイミド、1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド等の縮合剤の存在下、例えばN - ヒドロキシスクシンイミド、N - ヒドロキシフタルイミド、1 - ヒドロキシベンゾトリアゾール等のN - ヒドロキシ化合物；4 - ニトロフェノール、2, 4 - ジニトロフェノール、2, 4, 5 - トリクロロフェノール、ペンタクロロフェノール等のフェノール化合物等と反応させることにより得ることができる。

- 一般式 1 のカルボン酸の活性アミドは、一般式 1 のカルボン酸を常法に従って、例えば1, 1' - カルボニルジイミダゾール、1, 1' - カルボニルビス (2 - メチルイミダゾール) 等と反応させることにより得ることができる。

- 一般式 (V) で表される化合物と一般式 1 で表されるカルボン酸の反応性誘導体との反応は、通常、一般式 (V) で表される化合物 1 モルに対して、一般式 1 で表されるカルボン酸の反応性誘導体を 0.5 モルないし過剰モル、好ましくは 1 モルないし 1.5 モル用いて行われる。

反応は、通常、不活性溶媒中で行われ、当該不活性溶媒としては、例えば塩化メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ピリジン等又はその混合溶媒等が好適である。

- また、上記反応は塩基の非存在下でも進行するが、より円滑に反応を進行させるため塩基の存在下に行うことが好ましい。

当該塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4 - ジメチルアミノピリジン等の有機塩基又は水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基を使用することができる。

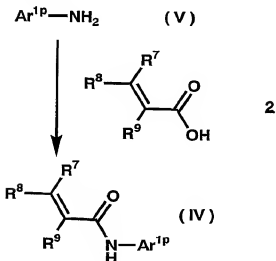
当該塩基は、通常、一般式(V)で表される化合物1モルに対して、1モルないし過剰モル用いるのが好適である。また当該塩基が液体である場合には、当該塩基を溶媒兼塩基として用いることができる。

反応温度は、通常、 $-50^{\circ}\text{C}$ ないし $100^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは $-20^{\circ}\text{C}$ ないし $50^{\circ}\text{C}$ である。

反応時間は、通常、5分間ないし7日間、好ましくは30分間ないし24時間である。

なお、一般式(V)又は1で表される化合物は市販品を用いるか、公知の方法又はそれらに準じる方法を必要に応じ適宜組み合わせることにより製造することができる。

#### 製造法B



[式中、 $\text{Ar}^{1\text{P}}$ 、 $\text{R}^7$ 、 $\text{R}^8$ 及び $\text{R}^9$ は前記の意味を有する]

本製造法は一般式(I V)で表される化合物の製造法である。

一般式(V)で表される化合物と一般式2で表されるカルボン酸との反応は、通常、一般式(V)で表される化合物1モルに対して、一般式2で表されるカルボン酸を0.5モルないし過剰モル、好ましくは1モルないし1.5モル用いて行われる。

反応は、通常、不活性溶媒中で行われ、当該不活性溶媒としては、例えば塩化メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ピリジン等又はその混合溶媒等が好適である。

また、上記反応は縮合剤の存在下に行うことが好ましく、当該縮合剤としては、例えばN, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、N, N'-ジイソプロピルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩、

5   ベンゾトリアゾール-1-イルオキシートリス-(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、ベンゾトリアゾール-1-イルオキシートリス-  
 -ピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、プロモトリス-(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、ジフェニルりん酸アジド、1, 1'-カルボニルジイミダゾール等を使用することができる。

- 10   当該縮合剤は、通常、一般式2で表される化合物1モルに対して、1モルないし過剰モル、好ましくは1モルないし1.5モルを用いることができる。

反応温度は、通常、-50℃ないし100℃、好ましくは-20℃ないし50℃である。

- 15   反応時間は、通常、30分間ないし7日間、好ましくは1時間ないし24時間である。

一般式2で表されるカルボン酸に代えて、該カルボン酸の反応性誘導体と一般式(V)で表される化合物とを反応させることにより、一般式(IV)で表される化合物を製造することもできる。

- 20   一般式2で表されるカルボン酸の反応性誘導体としては、例えば酸ハロゲン化物、混合酸無水物、活性エステル、活性アミド等が用いられる。

一般式2のカルボン酸の酸ハロゲン化物は、一般式2のカルボン酸を常法に従ってハロゲン化剤と反応させることにより得ることができる。ハロゲン化剤としては、例えば塩化チオニル、三塩化りん、五塩化りん、オキシ塩化りん、三臭化りん、オキサリルクロリド、ホスゲン等が用いられる。

- 25   一般式2のカルボン酸の混合酸無水物は、一般式2のカルボン酸を常法に従って、例えばクロロ炭酸エチル等のクロロ炭酸アルキル；ビパロイルクロリド等の脂肪族カルボン酸クロリド等と反応させることにより得ることができる。

一般式2のカルボン酸の活性エステルは、一般式2のカルボン酸を常法に従って、例えばN, N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-(3-ジメチルア

ミノプロピル) - 3-エチルカルボジイミド等の縮合剤の存在下、例えばN-ヒドロキシスクシンイミド、N-ヒドロキシフタルイミド、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール等のN-ヒドロキシ化合物; 4-ニトロフェノール、2, 4-ジニトロフェノール、2, 4, 5-トリクロロフェノール、ペンタクロロフェノール  
5 等のフェノール化合物等と反応させることにより得ることができる。

一般式2のカルボン酸の活性アミドは、一般式2のカルボン酸を常法に従って、例えば1, 1'-カルボニルジイミダゾール、1, 1'-カルボニルビス(2-メチルイミダゾール)等と反応させることにより得ることができる。

一般式2で表される化合物と一般式2で表されるカルボン酸の反応性誘導体と  
10 の反応は、通常、一般式(V)で表される化合物1モルに対して、一般式2で表されるカルボン酸の反応性誘導体を0.5モルないし過剰モル、好ましくは1モルないし1.5モル用いて行われる。

反応は、通常、不活性溶媒中で行われ、当該不活性溶媒としては、例えば塩化メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ピリジン等又はその混合溶媒等が好適である。  
15

また、上記反応は塩基の非存在下でも進行するが、より円滑に反応を進行させるため塩基の存在下に行うことが好ましい。

当該塩基としては、例えばトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基又は水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基を使用することができる。  
20

当該塩基は、通常、一般式(V)で表される化合物1モルに対して、1モルないし過剰モル用いるのが好適である。また当該塩基が液体である場合には、当該塩基を溶媒兼塩基として用いることができる。

25 反応温度は、通常、-50℃ないし100℃、好ましくは-20℃ないし50℃である。

反応時間は、通常、5分間ないし7日間、好ましくは30分間ないし24時間である。

なお、一般式2で表される化合物は市販品を用いるか、公知の方法又はそれら

に準じる方法を必要に応じ適宜組み合わせることにより製造することができる。

本発明の化合物の医薬としての有用性は、例えば下記の薬理試験例においてNPY拮抗活性を示すことにより証明される。

薬理試験例1 (NPY結合阻害試験)

- 5 ヒトNPY Y5受容体をコードするcDNA配列[国際特許出願WO96/16542号明細書参照]を、発現ベクターpCDNA3、pRc/RSV(インビトロジェン社製)及びpCI-neo(プロメガ社製)にクローニングした。得られた発現ベクターをカチオン性脂質法[プロシーディング・オブ・ザ・ナショナル・アカデミー・オブ・サイエンス・オブ・ザ・ユナイテッド・ステーツ・
- 10 オブ・アメリカ(Proceedings of the national academy of sciences of the united states of America)、84巻、7413頁(1987年参照)]を用いて宿主細胞COS-7、CHO及びLM(tk-) (アメリカン・タイプ・カルチャー・コレクション)にトランスフェクトし、NPY Y5受容体発現細胞
- 15 胞を得た。

- NPY Y5受容体を発現させた細胞から調製した膜標品を被検化合物及び20,000cpmの $[^{125}\text{I}]$ ペプチドYY(NEN社製)とともに、アッセイ緩衝液(10mM塩化マグネシウム、1mMフェニルメチルスルホニルフルオリド、0.1%バシトラシン及び0.5%ウシ血清アルブミンを含む25mM Tris緩衝液、pH7.4)中で25℃、2時間インキュベーションした後、グラスフィルターGF/Cにて濾過した。0.3%BSAを含む5mM Tris緩衝液、pH7.4にて洗浄後、グラスフィルター上の放射活性を求めた。非特異的結合は1 $\mu\text{M}$ ペプチドYY存在下で測定し、特異的ペプチドYY結合に対する被検化合物の50%阻害濃度(IC<sub>50</sub>値)を求めた[エンドクリノ
- 25 ロジー(Endocrinology)、131巻、2090頁(1992年参照)]。その結果を表9に示す。

表9 NPY受容体結合阻害作用

化合物	IC <sub>50</sub> 値(nM)
実施例 1	3.2
実施例 4	10
実施例 29	2.4

上記に示すとおり、本発明の化合物はNPY Y5受容体に対するペプチドYY (NPYと同族物質) の結合を強力に阻害した。

薬理試験例2 (bPPにより誘発される摂食行動に対する拮抗試験)

- 5      ペントバルビタール麻酔下 (50 mg/kg 腹腔内単回投与)、雄性SDラット (7-8週令、200-300 g) の右側脳室に脳定位固定的に慢性ガイドカニューレ (外径0.8 mm、内径0.5 mm、長さ10 mm) を挿入、歯科用レジンで固定した。ガイドカニューレの先端の位置はbregmaより後方0.9 mm、正中線より右に1.2 mm、脳表面より深さ1.5 mmとし、内針を挿入した際にその先端約2 mmがガイドカニューレの先端から出て、側脳室に達するようにした。約1週間の回復期間の後、ウシバンクレアチックポリペプチド (bPP、5 μg/10 μL/head、0.05%ウシ血清アルブミンを含む0.01 M、pH7.4リン酸緩衝生理食塩水) を側脳室内に投与した。被検化合物はbPP投与の2時間前に0.5%メチルセルロース水溶液に懸濁して経口投与し、bPP投与後2時間の摂餌量を測定した。

本発明の化合物は側脳室内に投与したbPP (NPYと同族物質) による摂食量の増加を有意に抑制した。

- 一般式(I)で表される化合物は、経口又は非経口的に投与することができ、そしてそのような投与に適する形態に製剤化することにより、NPYが関与する各種の疾患、すなわち、例えば高血圧、腎臓病、心疾患、血管れん縮、動脈硬化症等の循環器系疾患、例えば過食症、うつ病、不安、痙攣、てんかん、痴呆、痛み、アルコール依存症、薬物の断薬に伴う禁断症状、概日リズムの変調、精神分



裂病（統合失調症）等の中枢性疾患、例えば肥満症、糖尿病、ホルモン異常、高コレステロール血症、高脂血症等の代謝性疾患、性及び生殖機能障害、例えば消化管運動障害等の消化器系疾患、呼吸器系疾患、炎症又は緑内障等、より好ましくは過食症、肥満症、糖尿病等の処置剤として供することができる。本発明の化合物を臨床的に用いるにあたり、その投与形態に合わせ、薬剤学的に許容される添加剤を加えて各種製剤化の後投与することも可能である。その際の添加剤としては、製剤分野において通常用いられる各種の添加剤が使用可能であり、例えばゼラチン、乳糖、白糖、酸化チタン、デンプン、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、トウモロコシデンプン、マイクロクリスタリンワックス、白色ワセリン、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム、無水リン酸カルシウム、クエン酸、クエン酸三ナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ソルビトール、ソルビタン脂肪酸エステル、ポリソルベート、ショ糖脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン、硬化ヒマシ油、ポリビニルピロリドン、ステアリン酸マグネシウム、軽質無水ケイ酸、タルク、植物油、ベンジルアルコール、アラビアゴム、プロピレングリコール、ポリアルキレングリコール、シクロデキストリン又はヒドロキシプロピルシクロデキストリン等が挙げられる。

これらの添加剤との混合物として製剤化される剤形としては、例えば錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤若しくは坐剤等の固形製剤；又は例えばシロップ剤、エリキシル剤若しくは注射剤等の液体製剤等が挙げられ、これらは、製剤分野における通常の方法に従って調製することができる。なお、液体製剤にあっては、用時に水又は他の適当な媒体に溶解又は懸濁させる形であってもよい。また、特に注射剤の場合、必要に応じて生理食塩水又はブドウ糖液に溶解又は懸濁させてもよく、更に緩衝剤や保存剤を添加してもよい。

これらの製剤は、本発明の化合物を全薬剤 1.0 ~ 100 重量%、好ましくは 1.0 ~ 60 重量%の割合で含有することができる。これらの製剤は、また、治療上有効な他の化合物を含んでもよい。

本発明化合物は代謝障害及び／又は摂食障害の処置に有用な他剤と組み合わせで使用することができる。そのような組み合わせの個々の成分は、処置期間中、別々の異なる時に又は同時に、分割された又は単一の製剤で投与することができ

る。したがって、本発明は同時の又は時間が異なる投与の全てを含むと解釈すべきであり、本発明における投与はそのように解釈すべきである。本発明化合物と代謝障害及び／又は摂食障害の処置に有用な他剤との組み合わせの範囲には、原則として代謝障害及び／又は摂食障害の処置に有用ないかなる医薬製剤との組み合わせも包含される。

本発明の化合物を例えば臨床の場で使用する場合、その投与量及び投与回数は、患者の性別、年齢、体重、症状の程度及び目的とする処置効果の種類と範囲等により異なるが、一般に経口投与の場合、成人1日あたり、0.01~100mg/kg、好ましくは0.03~3mg/kgを1~数回に分けて、また非経口投与の場合は、0.001~10mg/kg、好ましくは0.001~0.1mg/kgを1~数回に分けて投与するのが好ましい。

通常の内科医、獣医又は臨床医は病状進行を阻止し、抑制し又は停止させるに必要な効果的薬物量を容易に決定し処理することができる。

## 15 発明を実施するための最良の形態

実施例を挙げて本発明を更に具体的に説明するが、本発明はこれらによって何ら限定されるものではない。

なお、融点はMP-S3モデル（柳本製作所製）を用いて測定し、補正を加えず記した。

### 20 実施例1

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[イン  
ドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]アセトアミド塩酸塩の製造

(1) N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-クロロアセトアミドの製造

4-アミノベンゾフェノン(197mg)及びトリエチルアミン(279μl)のクロロホルム(2ml)溶液に、氷冷下クロロアセチルクロリド(159μl)を滴下した。10分間攪拌後、反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後、酢酸エチルより結晶化し表題化合物(241mg)を得た。

(2) N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミドの製造

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-クロロアセトアミド(137mg)及び1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]塩酸塩(151mg)の5  
アセトン(2ml)の懸濁液に炭酸カリウム(140mg)を加え15時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン/酢酸エチル=1/1)にて精製し、表題化合物を得た。

10 (3) N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド塩酸塩の製造

上記、N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミドを4N塩酸-酢酸エチル溶液で処理した。生じた結晶を濾取し、表題化合物(212mg)15  
を得た。

融点178-180℃

実施例1-(2)で用いたN-(4-ベンゾイルフェニル)-2-クロロアセトアミドを、それぞれ所望の化合物に対応する原料に替え、他は実施例1-(2)  
20 )と同様にして実施例2~22の化合物を得た。

#### 実施例2

N-(2-ピフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

25 融点204-205℃

#### 実施例3

N-(3-ピフェニリル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

融点 112-115℃

実施例 4

5 N-(4-ビフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル] アセトアミド

融点 239-240℃

実施例 5

10 N-(5-ベンゾイル-2-ピリジル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル] アセトアミド

融点 175-177℃

実施例 6

15 N-(3-クロロフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル] アセトアミド

融点 191-193℃

実施例 7

20 N-(4-クロロフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル] アセトアミド

融点 181-182℃

実施例 8

25 2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-2-チアゾリル) アセトアミド

融点 234-238℃

実施例 9

2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン]-

1' - イル] - N - (5 - フェニル - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル)  
アセトアミド

融点 239 - 242 °C

5 実施例 10

2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ビペリジン] -  
1' - イル] - N - (5 - フェニル - 2 - ピラジニル) アセトアミド

融点 257 - 259 °C

10 実施例 11

2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ビペリジン] -  
1' - イル] - N - (4 - フェニル - 2 - チアゾリル) アセトアミド

融点 103 - 106 °C

15 実施例 12

2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ビペリジン] -  
1' - イル] - N - (3 - フェニル - 5 - イソオキサゾリル) アセトアミド

融点 207 - 209 °C

20 実施例 13

2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ビペリジン] -  
1' - イル] - N - (2 - フェニル - 4 - ピリミジニル) アセトアミド

融点 176 - 178 °C

25 実施例 14

2 - [1 - メチルスルホニルスピロ [インドリン - 3, 4' - ビペリジン] -  
1' - イル] - N - (4 - フェニル - 2 - ピリミジニル) アセトアミド

融点 195 - 198 °C

## 実施例 15

2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン] -  
1'-イル] -N- (1-フェニル-4-イミダゾリル) アセトアミド

融点 208-221℃

5

## 実施例 16

N- (6-メトキシ-7-アザベンゾチアゾール-2-イル) -2- [1-メ  
チルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン] -1'-イル] ア  
セトアミド

10 融点 285-288℃

## 実施例 17

N- (2-ベンゾチアゾリル) -2- [1-メチルスルホニルスピロ [インド  
リン-3, 4'-ピペリジン] -1'-イル] アセトアミド

15 融点 218-219℃

## 実施例 18

N- (6-メチル-2-キノリル) -2- [1-メチルスルホニルスピロ [イ  
ンドリン-3, 4'-ピペリジン] -1'-イル] アセトアミド

20 融点 132-136℃

## 実施例 19

N- (4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル) -2- [1-メチルスルホニルス  
ピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン] -1'-イル] アセトアミド

25 融点 162-165℃

## 実施例 20

N- (6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル) -2- [1-メチルスルホニルス  
ピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン] -1'-イル] アセトアミド

融点 268-270℃

# 実施例 21

2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -  
5 1'-イル] -N-(1-ナフチル) アセトアミド

融点 185-186℃

# 実施例 22

N-(5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル) -2- [1-メチルスルホニル  
10 スピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド

融点 229-230℃

所望の化合物に対応するスピロビペリジン及びクロロアセトアミド誘導体を用  
い、実施例 1-(2) と同様にして実施例 23~30 の化合物を得た。

15

# 実施例 23

N-(4-ベンゾイルフェニル) -2- [1-エチルスルホニルスピロ [イン  
ドリリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>, δ ppm) : 1.41 (3H, t,  
20 J=7.7Hz), 1.78-1.86 (2H, m), 2.00-2.09 (2  
H, m), 2.38-2.98 (2H, m), 2.92-2.99 (2H, m),  
3.14 (2H, q, J=7.7Hz), 3.22 (2H, s), 3.90 (2  
H, s), 7.06 (1H, t, J=7.1Hz), 7.20-7.59 (6H,  
m), 7.70-7.86 (6H, m), 9.30 (1H, s).

25

# 実施例 24

N-(4-ベンゾイルフェニル) -2- [1-アセチルスピロ [インドリン-  
3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド

<sup>1</sup>H-NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>, δ ppm) : 1.73-1.84 (

2H, m), 1.98-2.10 (2H, m), 2.27 (3H, s), 2.39-2.50 (2H, m), 2.92-3.05 (2H, m), 3.23 (2H, s), 3.89 (2H, s), 7.07-7.28 (3H, m), 7.45-7.60 (3H, m), 7.70-7.88 (6H, m), 8.23 (1H, d, J = 7.5 Hz), 9.32 (1H, s).

#### 実施例 25

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[7-アザインドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

<sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, CD<sub>3</sub>OD, δ ppm): 1.86-1.77 (2H, m), 2.18-2.07 (2H, m), 2.50-2.41 (2H, m), 3.00-2.94 (2H, m), 3.27 (3H, s), 3.96 (2H, brs), 4.91-4.83 (2H, m), 7.06-7.01 (1H, m), 7.57-7.49 (2H, m), 7.66-7.60 (1H, m), 7.81-7.70 (6H, m), 8.12-8.09 (1H, m).

#### 実施例 26

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[2-ヒドロキシ-1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

融点 124-127℃

#### 実施例 27

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[3, 4-ジヒドロ-3-オキソスピロ[イソキノリン-1 (2H), 4'-ピペリジン]-1'-イル]アセトアミド

融点 164-167℃

#### 実施例 28

2-[3, 4-ジヒドロ-3-オキソスピロ[イソキノリン-1 (2H), 4



’-ビペリジン]-1’-イル]-N-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)  
)アセトアミド

融点 230-233℃

5 実施例 29

2-[3-オキソスピロ[イソベンゾフラン-1(3H), 4’-ビペリジン]  
-1’-イル]-N-(2-フェニル-4-ピリジル)アセトアミド

融点 213-214℃

10 実施例 30

2-[3-オキソスピロ[6-アザイソベンゾフラン-1(3H), 4’-ビ  
ペリジン]-1’-イル]-N-(2-フェニル-4-ピリジル)アセトアミド

融点 224-225℃

15 実施例 31

2-[3-オキソスピロ[イソベンゾフラン-1(3H), 4’-ビペリジン]  
-1’-イル]-N-(1-フェニル-3-ピラゾリル)アセトアミド塩酸塩  
の製造

所望の化合物に対応するスピロビペリジン及びクロロアセトアミド誘導体を用

20 い、実施例 1 と同様にして表題化合物を得た。

融点 259-261℃

実施例 32

N-(3-ピフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン  
 25 -3, 4’-ビペリジン]-1’-イル]-2-フェニルアセトアミドの製造

N-(3-ピフェニル)-2-クロロ-2-フェニルアセトアミド (104 mg) 及び 1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4’-ビペリジン] 塩酸塩 (89 mg) のアセトン (5 ml) の懸濁液に、炭酸カリウム (122 mg) を加え 15 時間加熱還流した。室温に冷却後、反応液に水を加え酢酸エチル

にて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン／酢酸エチル＝1／2）にて精製し、表題化合物（58mg）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm) : 1.65–1.83 (2H, m), 2.00–2.18 (3H, m), 2.32–2.42 (1H, m), 2.78–2.81 (1H, m), 2.87 (3H, s), 3.10–3.18 (1H, m), 3.72 (1H, d,  $J=10.3\text{Hz}$ ), 3.78 (2H, d,  $J=10.3\text{Hz}$ ), 4.07 (1H, s), 7.09 (2H, t,  $J=6.7\text{Hz}$ ), 7.21–7.88 (17H, m), 9.21 (1H, s).

10

### 実施例33

N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]プロピオンアミドの製造

実施例32で用いたN-(3-ピフェニリル)-2-クロロ-2-フェニルアセトアミドを、N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-クロロプロピオンアミドに替え、他は実施例32と同様にして表題化合物を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm) : 1.37 (3H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 1.81–1.89 (2H, m), 1.97–2.09 (2H, m), 2.33–2.44 (1H, m), 2.56–2.67 (1H, m), 2.81–2.98 (2H, m), 2.93 (3H, s), 3.35 (1H, q,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 3.84 (2H, s), 7.09–7.13 (1H, m), 7.22–7.29 (2H, m), 7.42–7.51 (4H, m), 7.70–7.89 (6H, m), 9.53 (1H, s).

### 25 実施例34

2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]-N-(1-フェニル-4-イミダゾリル)プロピオンアミドの製造

N-(1-フェニル-4-イミダゾリル)-2-プロモプロピオンアミド(3

5 mg) 及び 1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン] 塩酸塩 (36 mg) のアセトン 2 ml の懸濁液に、炭酸カリウム (132 mg) 及びヨウ化ナトリウム (36 mg) を加え 24 時間攪拌した。反応液に水を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン/酢酸エチル=1/4) にて精製し、表題化合物 (22 mg) を得た。

融点 213-215℃

### 実施例 35

#### 10 N-(3-ピフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] プチルアミドの製造

実施例 34 で用いた N-(1-フェニル-4-イミダゾリル)-2-プロモプロピオンアミドを、N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-プロモプロチルアミドに替え、他は実施例 34 と同様にして表題化合物を得た。

15  $^1\text{H-NMR}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm) : 1.08 (3H, t,  $J=7.6$  Hz), 1.88-2.05 (6H, m), 2.32-2.57 (2H, m), 2.91 (3H, s), 2.91-3.05 (3H, m), 3.81 (1H, d,  $J=10.7$  Hz), 3.85 (1H, d,  $J=10.7$  Hz), 7.10 (1H, t,  $J=7.2$  Hz), 7.21-7.85 (12H, m),  
20 9.02 (1H, s) .

### 実施例 36

#### 25 N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル] プロピオンアミドの製造

1) N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-プロモ-2-メチルプロピオンアミドの製造

4-アミノベンゾフェノン (930 mg) 及びトリエチルアミン (1.0 ml) のテトラヒドロフラン (20 ml) 溶液に、氷冷下プロモイソブチルプロミ

ド (760  $\mu$ l) を滴下した。30分間攪拌後、反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後し表題化合物を得た。

- 5 (2) N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]プロピオンアミドの製造

1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]塩酸塩 (100mg) のテトラヒドロフラン (5ml) 懸濁液に水素化ナトリウム (60  
10 %油状, 140mg) を加え5分間攪拌後、N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-プロモ-2-メチルプロピオンアミド (114mg) のテトラヒドロフラン (1ml) 溶液を加えた。1.5時間攪拌後、反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出し有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン/酢酸エチル=1  
15 /1) にて精製し、表題化合物 (74mg) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm): 1.33 (6H, s), 1.75-1.85 (2H, m), 1.97-2.03 (2H, m), 2.38 (2H, t,  $J=11.5\text{Hz}$ ), 2.85-2.90 (2H, m), 2.90 (3H, s), 3.82 (2H, s), 7.08-7.26 (3H, m),  
20 7.40-7.60 (4H, m), 7.71-7.84 (6H, m), 9.57 (1H, s)。

実施例36で用いたN-(4-ベンゾイルフェニル)-2-プロモ-2-メチルプロピオンアミドを、それぞれ所望の化合物に対応する原料に替え、他は実施  
25 例36と同様にして実施例37~39の化合物を得た。

#### 実施例37

N-(3-ピフェニル)-2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ピペリジン]-1'-イル]プロピオンアミド

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm) : 1.35 (6H, s), 1.86 (2H, d,  $J=12.2\text{Hz}$ ), 2.00 (2H, d,  $J=12.2\text{Hz}$ ), 2.38 (2H, t,  $J=10.9\text{Hz}$ ), 2.88-2.92 (2H, m), 2.91 (3H, s), 3.83 (2H, s), 7.10 (1H, t,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 7.23-7.28 (2H, m), 7.31-7.50 (7H, m), 7.62 (1H, d,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 7.91 (1H, s), 9.37 (1H, s).

### 実施例 38

- 10 2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-3-ピリジル)プロピオンアミド

$^1\text{H-NMR}$  (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm) : 1.38 (6H, m), 1.82-1.90 (2H, m), 1.99-2.10 (2H, m), 2.38-2.48 (2H, m), 2.97 (3H, s), 2.92-2.97 (2H, m), 3.88 (2H, s), 7.10-7.70 (9H, m), 8.52-8.61 (2H, m), 9.53 (1H, s).

### 実施例 39

- 20 2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]-N-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)プロピオンアミド

融点  $76-79^\circ\text{C}$

### 25 実施例 40

N-(4-ベンゾイルフェニル)-3-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]プロピオンアミドの製造

1) N-(4-ベンゾイルフェニル)アクリルアミドの製造

4-アミノベンゾフェノン (1.0g) 及びピリジン (550  $\mu\text{l}$ ) のテトラ

ヒドロフラン（15 ml）溶液に、氷冷下アクリロイルクロリド（460  $\mu$ l）を滴下した。2時間攪拌後、反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、濃縮し表題化合物（1.05 g）を得た。

- 5 (2) N-（4-ベンゾイルフェニル）-3-〔1-メチルスルホニルスピロ〔インドリン-3, 4'-ピペリジン〕-1'-イル〕プロピオンアミドの製造

N-（4-ベンゾイルフェニル）アクリルアミド（48 mg）及び1-メチルスルホニルスピロ〔インドリン-3, 4'-ピペリジン〕塩酸塩（58 mg）のクロロホルム（3 ml）の懸濁液にトリエチルアミン（220  $\mu$ l）を加え80  
10 °Cで4時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。有機層を濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（メタノール／酢酸エチル＝5／95）にて精製し、表題化合物（70 mg）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ （300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$  ppm）：1.87-1.92（  
15 2H, m）, 2.01-2.12（2H, m）, 2.23-2.33（2H, m）, 2.61（2H, d,  $J=5.5$  Hz）, 2.82（2H, d,  $J=5.5$  Hz）, 2.94（3H, s）, 3.12-3.20（2H, m）, 7.10-7.30（3H, m）, 7.40-7.61（4H, m）, 7.68（2H, d,  $J=8.3$  Hz）, 7.78（2H, d,  $J=8.9$  Hz）, 7.88（2H,  
20 d,  $J=8.8$  Hz）。

#### 製剤例1

実施例1の化合物20.0 g、乳糖417 g、結晶セルロース80 g及び部分アルファー化デンプン80 gをV型混合機を用いて混合した後、ステアリン酸マグネシウム3.0 gを加え混合した。混合末を常法に従い打錠し直径7.0 mm、1錠の重量150 mgの錠剤3000錠を得た。

#### 一錠（150 mg）あたりの含有量

実施例1の化合物5.0 mg

乳糖104.25 mg

結晶セルロース 20.0 mg

部分アルファー化デンプン 20.0 mg

ステアリン酸マグネシウム 0.75 mg

製剤例 2

- 5     ヒドロキシプロピルセルロース 2910   10.8 g 及びポリエチレングリコール 6000   2.1 g を精製水 172.5 g に溶解した後、二酸化チタン 2.1 g を分散し、コーティング液を調製した。別に調製した製剤例 1 の錠剤 250 錠にハイコーターミニを用いてコーティング液をスプレーコーティングし、重量 155 mg のフィルムコート錠を得た。

10     一錠 (155 mg) あたりの含有量

製剤例 1 の錠剤 150 mg

ヒドロキシプロピルセルロース 2910   3.6 mg

ポリエチレングリコール 6000   0.7 mg

二酸化チタン 0.7 mg

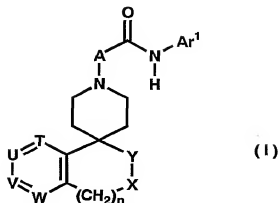
15

## 産業上の利用可能性

- 本発明の化合物は、NPY拮抗作用を有するため、NPYが関与する各種の疾患、すなわち、例えば高血圧、腎臓病、心疾患、血管れん縮、動脈硬化症等の循環器系疾患、例えば過食症、うつ病、不安、痙攣、てんかん、痴呆、痛み、アルコール依存症、薬物の断薬に伴う禁断症状、概日リズムの変調、精神分裂病（統合失調症）等の中枢性疾患、例えば肥満症、糖尿病、ホルモン異常、高コレステロール血症、高脂血症等の代謝性疾患、性及び生殖機能障害、例えば消化管運動障害等の消化器系疾患、呼吸器系疾患、炎症又は緑内障等の処置剤として有用である。
- 20

# 請 求 の 範 囲

## (1) 一般式 (I)



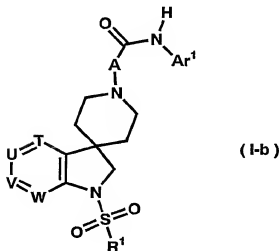
- 5    [式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；A r <sup>1</sup>はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-A r <sup>2</sup>で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；A r <sup>2</sup>はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、
- 10    低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；nは0又は1を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R <sup>1</sup>は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R <sup>2</sup>及びR <sup>5</sup>は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R <sup>3</sup>及びR <sup>4</sup>は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；
- 15    T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよい



メチン基又は窒素原子であつて、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味し；Xは $-N(SO_2R^1)-$ 、 $-N(COR^2)-$ 又は $-CO-$ で表される基を意味し；Yは $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-O-$ 又は $-N(R^5)-$ で表される基を意味する]で表される化合物、その塩又はエステル。

- 5 (2) Xが $-N(SO_2R^1)-$ 若しくは $-N(COR^2)-$ で表される基であり、  
nが0であり、かつYが $-C(R^3)(R^4)-$ で表される基であるか、又はXが  
 $-CO-$ で表される基であり、かつYが $-O-$ 若しくは $-N(R^5)-$ で表され  
る基である請求項1記載の化合物。

### (3) 一般式 (I - b)



- 10

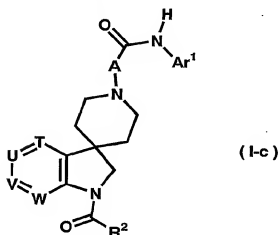
〔式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し； $R^{1}$ はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び $-Q-A R^{2}$ で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； $R^{2}$ はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有してい

- 15

- 20

てもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R<sup>1</sup>は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味する]で表される化合物である請求項1記載の化合物。

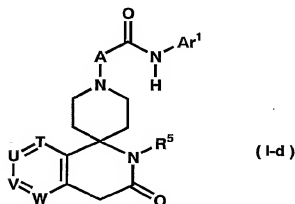
(4) 一般式 (I-c)



[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar<sup>1</sup>はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-Ar<sup>2</sup>で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar<sup>2</sup>はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R<sup>2</sup>は水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキ

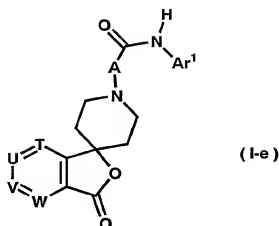
ル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味する]で表される化合物である請求項1記載の化合物。

(5) 一般式 (I-d)



[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar<sup>1</sup>はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-Ar<sup>2</sup>で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar<sup>2</sup>はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R<sup>5</sup>は水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味する]で表される化合物である請求項1記載の化合物。

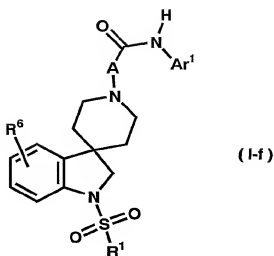
(6) 一般式 (I-e)



〔式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar<sup>1</sup>はハロゲン原子、ニトロ基、オキシ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-Ar<sup>2</sup>で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar<sup>2</sup>はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味する〕で表される化合物である請求項1記載の化合物。

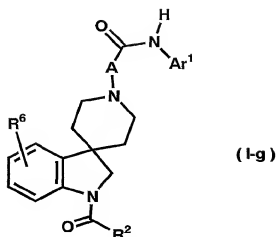
(7) T、U、V及びWのいずれか1つが窒素原子である請求項1、2、3、4、5又は6記載の化合物。

(8) 一般式(I-f)



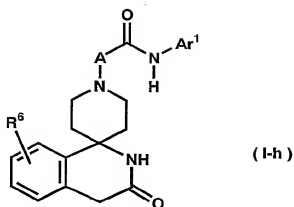
〔式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；A r<sup>1</sup>はハロゲン原子、ニトロ基、オキシ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-A r<sup>2</sup>で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；A r<sup>2</sup>はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R<sup>1</sup>は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R<sup>6</sup>は水素原子又はハロゲン原子を意味する〕で表される化合物である請求項1記載の化合物。

(9) 一般式 (I-g)



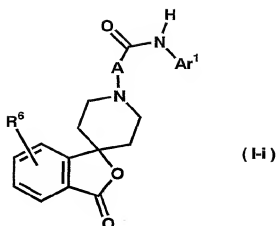
〔式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar<sup>1</sup>はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-Ar<sup>2</sup>で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar<sup>2</sup>はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R<sup>2</sup>は水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R<sup>6</sup>は水素原子又はハロゲン原子を意味する〕で表される化合物である請求項1記載の化合物。

(10) 一般式 (I-h)



〔式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar<sup>1</sup>はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-Ar<sup>2</sup>で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar<sup>2</sup>はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R<sup>6</sup>は水素原子又はハロゲン原子を意味する〕で表される化合物である請求項1記載の化合物。

(11) 一般式 (I-i)



〔式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar<sup>1</sup>はハロゲン原子、ニトロ基、オキシ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-Ar<sup>2</sup>で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar<sup>2</sup>はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R<sup>6</sup>は水素原子又はハロゲン原子を意味する〕で表される化合物である請求項1記載の化合物。

(12) Ar<sup>1</sup>がハロゲン原子、ニトロ基、オキシ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q-Ar<sup>2</sup>で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよいアリール基である請求項1、2、3、4、5、6、7、8、9、10又は11記載の化合物。

(13) Ar<sup>1</sup>がハロゲン原子、ニトロ基、オキシ基、低級アルキル基、ハロ低



級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び $Q-Ar^{22}$ で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよいヘテロアリール基である請求項1、2、3、4、5、6、7、8、9、10又は11記載の化合物。

- (14) N-(4-ベンゾイルフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
- N-(2-ビフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
- 10 N-(3-ビフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
- N-(4-ビフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
- 15 N-(5-ベンゾイル-2-ピリジル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
- N-(3-クロロフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
- N-(4-クロロフェニル)-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]アセトアミド、
- 20 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-2-チアゾリル)アセトアミド、
- 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)アセトアミド、
- 25 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]-N-(5-フェニル-2-ピラジニル)アセトアミド、
- 2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]-N-(4-フェニル-2-チアゾリル)アセトアミド、

- 2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -  
1'-イル] -N- (3-フェニル-5-イソオキサゾリル) アセトアミド、
- 2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -  
1'-イル] -N- (2-フェニル-4-ピリミジニル) アセトアミド、
- 5 2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -  
1'-イル] -N- (4-フェニル-2-ピリミジニル) アセトアミド、
- 2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -  
1'-イル] -N- (1-フェニル-4-イミダゾリル) アセトアミド、
- N- (6-メトキシ-7-アザベンゾチアゾール-2-イル) -2- [1-メ  
10 チルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] ア  
セトアミド、
- N- (2-ベンゾチアゾリル) -2- [1-メチルスルホニルスピロ [インド  
リン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、
- N- (6-メチル-2-キノリル) -2- [1-メチルスルホニルスピロ [イ  
15 ンドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、
- N- (4-クロロ-2-ベンゾチアゾリル) -2- [1-メチルスルホニルス  
ピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、
- N- (6-クロロ-2-ベンゾチアゾリル) -2- [1-メチルスルホニルス  
ピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、
- 20 2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -  
1'-イル] -N- (1-ナフチル) アセトアミド、
- N- (5-クロロ-2-ベンゾオキサゾリル) -2- [1-メチルスルホニル  
スピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、
- N- (4-ベンゾイルフェニル) -2- [1-エチルスルホニルスピロ [イン  
25 ドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、
- N- (4-ベンゾイルフェニル) -2- [1-アセチルスピロ [インドリン-  
3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、
- N- (4-ベンゾイルフェニル) -2- [1-メチルスルホニルスピロ [7-  
アザインドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、

N- (4-ベンゾイルフェニル) -2- [2-ヒドロキシ-1-メチルスルホ  
ニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミド、

N- (4-ベンゾイルフェニル) -2- [3, 4-ジヒドロ-3-オキソスピ  
ロ [イソキノリン-1 (2H), 4'-ビペリジン] -1'-イル] アセトアミ

5 ド、

2- [3, 4-ジヒドロ-3-オキソスピロ [イソキノリン-1 (2H), 4  
'-ビペリジン] -1'-イル] -N- (3-フェニル-5-イソオキサゾリル  
) アセトアミド、

2- [3-オキソスピロ [イソベンゾフラン-1 (3H), 4'-ビペリジン  
10 ] -1'-イル] -N- (2-フェニル-4-ピリジル) アセトアミド、

2- [3-オキソスピロ [6-アザイソベンゾフラン-1 (3H), 4'-ビ  
ペリジン] -1'-イル] -N- (2-フェニル-4-ピリジル) アセトアミド、

2- [3-オキソスピロ [イソベンゾフラン-1 (3H), 4'-ビペリジン  
] -1'-イル] -N- (1-フェニル-3-ピラゾリル) アセトアミド、

15 N- (3-ピフェニル) -2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン  
-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] -2-フェニルアセトアミド、

N- (4-ベンゾイルフェニル) -2- [1-メチルスルホニルスピロ [イン  
ドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] プロピオンアミド、

2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -  
20 1'-イル] -N- (1-フェニル-4-イミダゾリル) プロピオンアミド、

N- (3-ピフェニル) -2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン  
-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] ブチルアミド、

N- (4-ベンゾイルフェニル) -2-メチル-2- [1-メチルスルホニル  
スピロ [インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] プロピオンアミド、

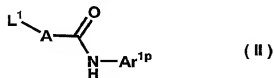
25 N- (3-ピフェニル) -2-メチル-2- [1-メチルスルホニルスピロ  
[インドリン-3, 4'-ビペリジン] -1'-イル] プロピオンアミド、

2-メチル-2- [1-メチルスルホニルスピロ [インドリン-3, 4'-ビ  
ペリジン] -1'-イル] -N- (5-フェニル-3-ピリジル) プロピオンア  
ミド、

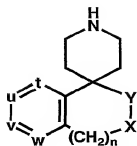
2-メチル-2-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]-N-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)プロピオンアミド又は

N-(4-ベンゾイルフェニル)-3-[1-メチルスルホニルスピロ[インドリン-3, 4'-ビペリジン]-1'-イル]プロピオンアミドである請求項1記載の化合物。

(15) 一般式 (I I)

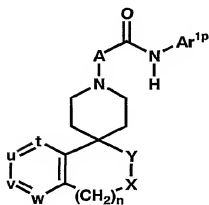


[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し；Ar<sup>1p</sup>はハロゲン原子、ニトロ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び-Q<sup>p</sup>-Ar<sup>2p</sup>で表される基並びに保護されていてもよい、オキソ基、ヒドロキシ低級アルキル基及びカルボキシル基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；Ar<sup>2p</sup>はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基並びに保護されていてもよい、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基及び低級アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；L<sup>1</sup>は脱離基を意味し；Q<sup>p</sup>は単結合又は保護されていてもよいカルボニル基を意味する]で表される化合物と、一般式 (I I I)



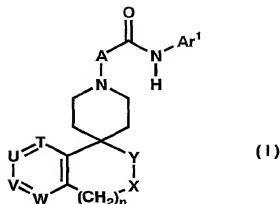
(III)

- [式中、nは0又は1を意味し；R<sup>1</sup>は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R<sup>2</sup>及びR<sup>5</sup>は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；t、u、v及びwは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基及び低級アルコキシ基並びに保護されていてもよい水酸基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味し；Xは-N(SO<sub>2</sub>R<sup>1</sup>)-、-N(COR<sup>2</sup>)-又は-CO-で表される基を意味し；Yは-C(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>)-、-O-又は-N(R<sup>5</sup>)-で表される基を意味する]で表される化合物とを反応させ、一般式(I')



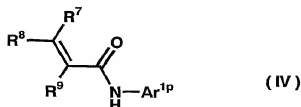
(I')

- [式中、A、Ar<sup>1p</sup>、n、t、u、v、w、X及びYは前記の意味を有する]で表される化合物とし、所望により保護基を除去することを特徴とする、一般式(I)



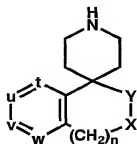
〔式中、 $Ar^1$ はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び $Q-Ar^2$ で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； $Ar^2$ はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； $Q$ は単結合又はカルボニル基を意味し； $T$ 、 $U$ 、 $V$ 及び $W$ は、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味し、 $A$ 、 $n$ 、 $X$ 及び $Y$ は前記の意味を有する〕で表される化合物、その塩又はエステル。の製造法。

(16) 一般式 (IV)



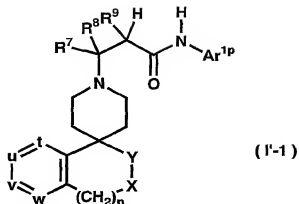
〔式中、 $Ar^{1p}$ はハロゲン原子、ニトロ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アル

- ルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボ  
 ニル基及び $-Q^p-Ar^{2p}$ で表される基並びに保護されていてもよい、オキシ基、  
 ヒドロキシ低級アルキル基及びカルボキシル基からなる群より選択される置換基  
 を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； $Ar^{2p}$ はハロ  
 5 ゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、低級アルコキシ基、  
 ハロ低級アルコキシ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリ  
 ール基並びに保護されていてもよい、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基及び低  
 級アルキルアミノ基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリ  
 ール基又はヘテロアリール基を意味し； $Q^p$ は単結合又は保護されていてもよい  
 10 カルボニル基を意味し； $R^7$ 、 $R^8$ 及び $R^9$ は、それぞれ独立して、水素原子、低  
 級アルキル基又はアラルキル基を意味する]で表される化合物と、一般式 (I I  
 I)

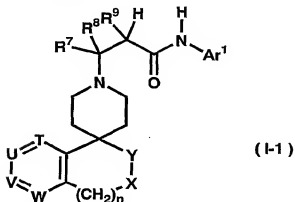


(III)

- [式中、nは0又は1を意味し； $R^1$ は低級アルキル基、アラルキル基又はアリ  
 ール基を意味し； $R^2$ 及び $R^5$ は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基  
 、アラルキル基又はアリール基を意味し； $R^3$ 及び $R^4$ は、それぞれ独立して、水  
 素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；t、  
 u、v及びwは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基及び低級アル  
 コキシ基並びに保護されていてもよい水酸基からなる群より選択される置換基  
 20 を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2  
 つが該メチン基を意味し；Xは $-N(SO_2R^1)-$ 、 $-N(COR^2)-$ 又は $-CO-$ で表される基を意味し；Yは $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-O-$ 又は $-N(R^5)-$   
 で表される基を意味する]で表される化合物とを反応させ、一般式 (I'  
 -1)



〔式中、 $Ar^{1p}$ 、 $n$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $t$ 、 $u$ 、 $v$ 、 $w$ 、 $X$ 及び $Y$ は前記の意味を有する〕で表される化合物とし、所望により保護基を除去することを特徴とする、一般式 (I-1)



5

〔式中、 $Ar^1$ はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシ基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び $-Q-Ar^2$ で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； $Ar^2$ はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； $Q$ は単結合又はカルボニル基を意味し； $T$ 、 $U$ 、 $V$ 及び $W$ は、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を

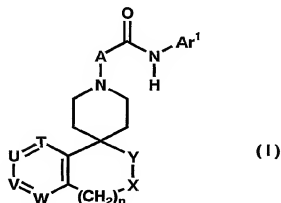
10

15



有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味し、 $n$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $X$ 及び $Y$ は前記の意味を有する]で表される化合物、その塩又はエステル製造法。

(17) 一般式 (I)

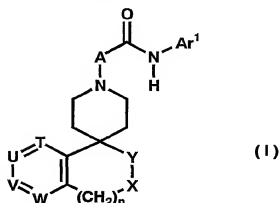


[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味し； $Ar^1$ はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び $-Q-Ar^2$ で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； $Ar^2$ はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し； $n$ は0又は1を意味し；Qは単結合又はカルボニル基を意味し； $R^1$ は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し； $R^2$ 及び $R^5$ は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し； $R^3$ 及び $R^4$ は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよい]

メチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味し；Xは $-N(SO_2R^1)-$ 、 $-N(COR^2)-$ 又は $-CO-$ で表される基を意味し；Yは $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-O-$ 又は $-N(R^5)-$ で表される基を意味する]で表される化合物、その塩又はエステルを有効成分とする神経ペプ

5 チドY受容体拮抗剤。

(18) 一般式 (I)



[式中、Aは低級アルキル基、アラルキル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい炭素数1ないし3の直鎖状アルキレン基を意味

10 し；Ar<sup>1</sup>はハロゲン原子、ニトロ基、オキソ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、シクロ低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、カルボキシル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び $-Q-Ar^2$ で表される基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又は

15 はヘテロアリール基を意味し；Ar<sup>2</sup>はハロゲン原子、シアノ基、低級アルキル基、ハロ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、水酸基、低級アルコキシ基、ハロ低級アルコキシ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、低級アルカノイル基及びアリール基からなる群より選択される置換基を有していてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を意味し；nは0又は1を意味し；

20 Qは単結合又はカルボニル基を意味し；R<sup>1</sup>は低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R<sup>2</sup>及びR<sup>5</sup>は、それぞれ独立して、水素原子、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し；R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、それぞれ独立して、水素原子、水酸基、低級アルキル基、アラルキル基又はアリール基を意味し

；T、U、V及びWは、それぞれ独立して、ハロゲン原子、低級アルキル基、水酸基及び低級アルコキシ基からなる群より選択される置換基を有していてもよいメチン基又は窒素原子であって、それらのうち少なくとも2つが該メチン基を意味し；Xは $-\text{N}(\text{SO}_2\text{R}^1)-$ 、 $-\text{N}(\text{COR}^2)-$ 又は $-\text{CO}-$ で表される基  
5 を意味し；Yは $-\text{C}(\text{R}^3)(\text{R}^4)-$ 、 $-\text{O}-$ 又は $-\text{N}(\text{R}^5)-$ で表される基を意味する]で表される化合物、その塩又はエステルを有効成分とする過食症、肥満症又は糖尿病の処置剤。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/04954

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.<sup>7</sup> C07D471/10, 471/20, 491/107, 491/20, 519/00, A61K31/438,  
31/444, 31/4709, 31/4747, 31/497, 31/506, A61P1/00, 3/04, 3/06, 3/10,  
5/00, 9/00, 9/10, 9/12, 9/14, 11/00, 13/12, 15/00, 25/00, 25/04,

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.<sup>7</sup> C07D471/10, 471/20, 491/107, 491/20, 519/00, A61K31/438,  
31/444, 31/4709, 31/4747, 31/497, 31/506

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 01/14376 A1 (Banyu Pharmaceutical Co., Ltd.), 01 March, 2001 (01.03.01), Claims & JP 2002-030086 A & AU 200064762 A & US 2002/0052371 A1 & US 6326375 B1 & US 6335345 B1 & BR 200013423 A & NO 200200814 A & US 6388077 B1 & EP 1204663 A1	1-18
Y	WO 00/27845 A1 (Merck & Co., Inc., Banyu Pharmaceutical Co., Ltd.), 18 March, 2000 (18.03.00), Claims & AU 200014732 A & US 2002/0058813 A1 & US 6313298 B1 & EP 1129089 A1	1-18

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"Z" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
26 August, 2002 (26.08.02)

Date of mailing of the international search report  
10 September, 2002 (10.09.02)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/04954

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y A	WO 99/64002 A1 (Merck & Co., Inc.), 16 December, 1999 (16.12.99), & AU 9946801 A1 & US 6294534 B1 & JP 2002-517444 A & US 2001/029259 A1 & US 6410548 B2	1-16, 18 17
Y A	WO 99/29696 A1 (F. Hoffmann-La Roche), 17 June, 1999 (17.06.99), Claims 1, 11 & ZA 9811345 A1 & AU 9921578 A & JP 2001-525414 A & CN 1281459 A & EP 1037892 A1 & BR 9813534 A & US 6166209 A & KR 2001023958 A & MX 2000005605 A1	1-16, 18 17
Y A	WO 94/13696 A1 (Merck & Co., Inc.), 23 June, 1994 (23.06.94), Claims; page 49 & US 5578593 A & WO 94/19367 A1 & IL 107836 A1 & EP 662481 A1 & ZA 9309272 A & ZA 9309274 A & JP 07-097367 A & CN 1092767 A & FI 9502862 A & NO 9502294 A	1-16, 18 17
Y A	WO 94/19367 A1 (Merck & Co., Inc.), 01 September, 1994 (01.09.94), Claims; page 57 & US 5536716 A & WO 94/13696 A1 & PL 176993 B1 & EP 615977 A1 & AU 9352320 A1 & AU 9352321 A1 & ZA 9309272 A & ZA 9309274 A & JP 06-263737 A & CN 1092071 A & FI 9502862 A & FI 9502863 A & NO 9502294 A & NO 9502295 A & US 5652235 A	1-16, 18 17
Y	WO 01/13917 A1 (Bristol-Myers Squibb Co.), 01 March, 2001 (01.03.01), Claims & US 6348472 B1 & EP 1206262 A1	1-17
Y	EP 747378 A1 (Bristol-Myers Squibb Co.), 11 December, 1996 (11.12.96), Claims & US 5554621 A & CA 2178414 A & AU 9654755 A1 & JP 09-012572 A	1-17
P, Y	WO 02/48152 A1 (Neurogen Corp.), 20 June, 2002 (20.06.02), (Family: none)	1-17

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/04954

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	MALMSTROM, Rickard E. et al., Pharmacology of H 394/84, a dihydropyridine neuropeptide Y Y1 receptor antagonist, in vivo, European Journal of Pharmacology, April, 2001, Vol.418, Nos. 1 to 2, pages 95 to 104	1-17

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/04954

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
(International Patent Classification (IPC))Int.Cl<sup>7</sup> 25/08, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30, 25/32, 27/06, 29/00, 43/00

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC)

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>1</sup> C07D471/10, 471/20, 491/107, 491/20, 519/00, A61K31/438, 31/444, 31/4709, 31/4747, 31/497, 31/506, A61P1/00, 3/04, 3/06, 3/10, 5/00, 9/00, 9/10, 9/12, 9/14, 11/00, 13/12, 15/00, 25/00, 25/04, 25/08, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30, 25/32, 27/06, 29/00, 43/00

## B. 調査を行った分野

## 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>1</sup> C07D471/10, 471/20, 491/107, 491/20, 519/00, A61K31/438, 31/444, 31/4709, 31/4747, 31/497, 31/506

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)  
CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリ*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	WO 01/14376 A1 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 2001.03.01, claim &JP 2002-030086 A &AU 200064762 A &US 2002/0052371 A1 &US 6326375 B1 &US 6335345 B1 &BR 200013423 A &NO 200200814 A &US 6388077 B1 &EP 1204663 A1	1-18
Y	WO 00/27845 A1 (MERCK & CO., INC., BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 2000.03.18, claim &AU 200014732 A &US 2002/0058813 A1 &US 6313298 B1 &EP 1129089 A1	1-18

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリ

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

2 6 . 0 8 . 0 2

国際調査報告の発送日 1 0 . 0 9 . 0 2

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JJP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

富永 保



4 P

3 1 2 4

電話番号 03-3581-1101 内線 3492



C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y A	WO 99/64002 A1 (MERCK & CO., INC.) 1999.12.16 &AU 9946801 A1 &US 6294534 B1 &JP 2002-517444 A &US 2001/029259 A1 &US 6410548 B2	1-16, 18 17
Y A	WO 99/29696 A1 (F. HOFFMANN-LA ROCHE) 1999.06.17, claim1, 11, &ZA 9811345 A1 &AU 9921578 A &JP 2001-525414 A &CN 1281459 A &EP 1037892 A1 &BR 9813534 A &US 6166209 A &KR 2001023958 A &MX 2000005605 A1	1-16, 18 17
Y A	WO 94/13696 A1 (MERCK & CO., INC.) 1994.06.23, claim, p49 &US 5578593 A &WO 94/19367 A1 &IL 107836 A1 &EP 662481 A1 &ZA 9309272 A &ZA 9309274 A &JP 07-097367 A &CN 1092767 A &F I 9502862 A &NO 9502294 A	1-16, 18 17
Y A	WO 94/19367 A1 (MERCK & CO., INC.) 1994.09.01, claim, p57 &US 5536716 A &WO 94/13696 A1 &PL 176993 B1 &EP 615977 A1 &AU 9352320 A1 &AU 9352321 A1 &ZA 9309272 A &ZA 9309274 A &JP 06-263737 A &CN 1092071 A &FI 9502862 A &FI 9502863 A &NO 9502294 A &NO 9502295 A &US 5652235 A	1-16, 18 17
Y	WO 01/13917 A1 (Bristol-Myers Squibb Company) 2001.03.01, claim他 &US 6348472 B1 &EP 1206262 A1	1-17
Y	EP 747378 A1 (Bristol-Myers Squibb Company) 1996.12.11, claim他 &US 5554621 A &CA 2178414 A &AU 9654755 A1 &JP 09-012572 A	1-17
PY	WO 02/48152 A1 (Neurogen Corporation) 2002.06.20 (ファミリーなし)	1-17
A	MALMSTROM, Rickard E. 他, Pharmacology of H 394/84, a dihydropyridine neuropeptide Y Y1 receptor antagonist, in vivo, European Journal of Pharmacology, April 2001, Vol. 418, No. 1-2, pages 95-104	1-17